

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平7-145147

(43) 公開日 平成7年(1995)6月6日

(51) Int.Cl. <sup>6</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D 209/04		8217-4C		
209/82		8217-4C		
215/20				
307/79				
307/91				

審査請求 未請求 請求項の数 7 O L (全 70 頁) 最終頁に続く

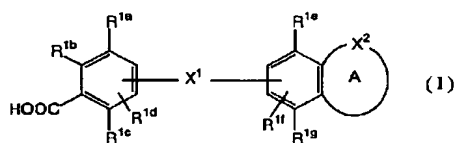
(21) 出願番号	特願平5-296321	(71) 出願人	000006677 山之内製薬株式会社 東京都中央区日本橋本町2丁目3番11号
(22) 出願日	平成5年(1993)11月26日	(72) 発明者	五十嵐 進 茨城県つくば市二の宮2-5-9 ルーミ 一筑波318号
		(72) 発明者	伊坂 雅彦 茨城県つくば市二の宮2-5-9 ルーミ 一筑波208号
		(72) 発明者	井波 寛 茨城県つくば市二の宮3-13-1 ルーミ 一にのみや403号
		(74) 代理人	弁理士 渡邊 一平 (外3名) 最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 安息香酸誘導体又はその塩

(57) 【要約】

【構成】 下記一般式 (I)

【化1】



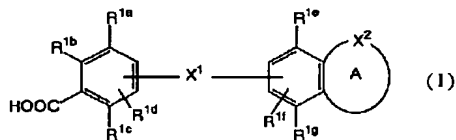
で示される安息香酸誘導体又はその塩。

【効果】 テストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼ阻害剤として有用であり、前立腺肥大、前立腺癌等の治療に用いられる。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記一般式（I）で示される安息香酸誘導体又はその塩。

【化1】



【式中の基は以下の意味を有する。

R<sup>1a</sup>乃至R<sup>1g</sup>：同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲンメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はモノー若しくはジ低級アルキルアミノ基

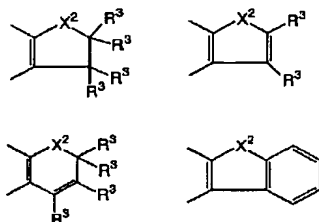
X<sup>1</sup>：酸素原子又は硫黄原子

X<sup>2</sup>：酸素原子、硫黄原子又は下記式で示される基

【化2】



R<sup>2</sup>：水素原子；シクロアルキル基又はアリールオキシ



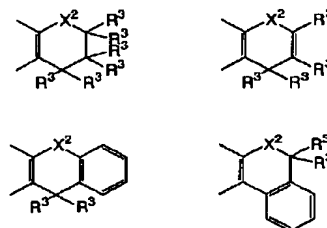
R<sup>3</sup>：同一又は異なって水素原子、アリール基で置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲンメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はモノー若しくはジ低級アルキルアミノ基、アシル基、アリール基、アリールカルボニル基であって該アリール基及び該アリールカルボニル基は、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲンメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はモノー若しくはジ低級アルキルアミノ基で置換されていてもよく、アラルキル基であって該アラルキル基は、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲンメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はモノー若しくはジ低級アルキルアミノ基で置換されていてもよい。或は、R<sup>3</sup>が同一炭素原子に結合して、下記式で示される基の場合

【化4】

基で置換されていてもよい低級アルキル基であって該シクロアルキル基又はアリールオキシ基は、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲンメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、モノー若しくはジ低級アルキルアミノ基、アリール基で置換されていてもよい基；アリール基又は窒素原子を含む複素環基であって、該アリール基又は窒素原子を含む複素環基は、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲンメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はモノー若しくはジ低級アルキルアミノ基で置換されていてもよい基；アラルキル基であって該アラルキル基は、低級アルキル基、低級アルケニル基、アリール基で置換されていてもよい低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲンメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、モノー若しくはジ低級アルキルアミノ基、シクロアルキル基、アリール基、アリールオキシ基、ビスシクロアルキル基で置換されていてもよい基。

A環：下記式で示される基

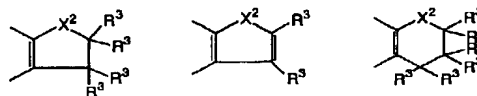
【化3】



R<sup>3</sup>は一体となりオキシ基又はチオキシ基を意味する。]

【請求項2】 A環が下記式で示される基であることを特徴とする請求項1記載の化合物又はその塩。

【化5】



【請求項3】 R<sup>1a</sup>がハロゲン原子であり、R<sup>1b</sup>乃至R<sup>1g</sup>が水素原子である請求項2記載の化合物又はその塩。

【請求項4】 4-[1-(4-ピフェニルメチル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]-3-クロロ安息香酸又はその塩。

【請求項5】 3-クロロ-4-[(1-イソアミル-1H-インドール-5-イル)オキシ]安息香酸又はその塩。

【請求項6】 3-クロロ-4-[1-(4-フェノ

キシベンジル) - 1H-インドール-5-イル] オキシ] 安息香酸又はその塩。

【請求項7】 3-クロロ-4- [ [1- (4-フェノキシベンジル) - 5-インドリニル] オキシ] 安息香酸又はその塩。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】 本発明は医薬として有用な、更に詳細には、テストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼ阻害性を有する新規な安息香酸誘導体及びその製薬学的に許容される塩に関する。

【0002】

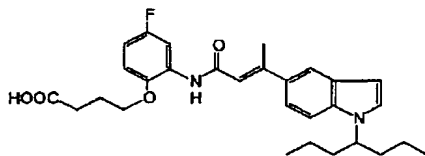
【従来の技術】 精巣および副腎より分泌されるテストステロン (TS) は、アンドロジェン標的細胞に取り込まれたのち、細胞内に存在する 5 $\alpha$ -レダクターゼの作用を受けてジヒドロテストステロン (DHT) に還元される。このようにして生成された DHT は、前立腺肥大および前立腺癌の発生に密接な関係があると考えられている。さらに、男性型脱毛症、 $\Delta$ 座 $\nabla$ 瘡や脂漏等の発生、亢進も DHT および TS の過剰が原因の一つであると考えられている。

【0003】 従って、TS がよりアンドロジェン活性の高い DHT に還元される作用を抑制することは、前立腺肥大等の疾病に対し極めて有効であると考えられており、従来よりテストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼ阻害作用を有する化合物の合成研究が種々試みられてきた。従来、テストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼ阻害性を有する物質としては、ステロイドタイプの化合物と非ステロイドタイプの化合物が知られている。ステロイドタイプの化合物としては例えば特公昭 63-65080 号公報記載の化合物が、また非ステロイドタイプの化合物としては例えばヨーロッパ公開特許第 511, 477 号公報及びヨーロッパ公開特許第 458, 207 号公報には、下記式で示される化合物が夫々記載されている。

ヨーロッパ公開特許第 511, 477 号公報

【0004】

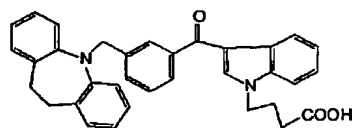
【化6】



【0005】 ヨーロッパ公開特許第 458, 207 号公報

【0006】

【化7】



【0007】 しかしながら、同公報にはこれらの化合物が、ラット由来のテストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼに対して良好な阻害活性を有することが記載されているが、ヒト由来のテストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼに対する阻害作用は十分なものではなかった。

【0008】

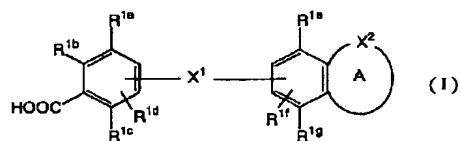
【発明が解決しようとする課題】 今回、本発明者等は、上記の従来知られている化合物とは全く構造を異にする、非ステロイドタイプの化合物である下記一般式

(I) で示される安息香酸誘導体又はその製薬学的に許容される塩に、従来知られている非ステロイドタイプの化合物と比較して優れたテストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼ阻害作用があることを認め、本発明を完成した。即ち、本発明化合物は、従来知られている非ステロイドタイプの化合物と異なりヒト由来のテストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼに対して優れた阻害作用を示す化合物である。

【0009】 すなわち、本発明は下記一般式 (I) で示される安息香酸誘導体又はその製薬学的に許容される塩を提供することを目的とするものである。

【0010】

【化8】



【0011】 【式中の基は以下の意味を有する。

R<sup>1a</sup>乃至R<sup>1g</sup>: 同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲノメチル基、水酸基、低級アルキコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はモノー若しくはジー低級アルキルアミノ基

X<sup>1</sup>: 酸素原子又は硫黄原子

X<sup>2</sup>: 酸素原子、硫黄原子又は下記式で示される基

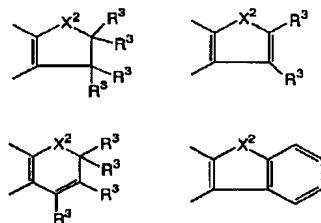
【0012】

【化9】



【0013】 R<sup>2</sup>: 水素原子；シクロアルキル基又はアリールオキシ基で置換されていてもよい低級アルキル基であって該シクロアルキル基又はアリールオキシ基は、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲノメチル基、水酸基、低

級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、モノー若しくはジー低級アルキルアミノ基、アリール基で置換されていてもよい基；アリール基又は窒素原子を含む複素環基であって、該アリール基又は窒素原子を含む複素環基は、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲノメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はモノー若しくはジー低級アルキルアミノ基で置換されていてもよい基；アラルキル基であって該アラルキル基は、低級アルキル基、低級アルケニル基、アリール



【0015】R<sup>3</sup>：同一又は異なって水素原子、アリール基で置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲノメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はモノー若しくはジー低級アルキルアミノ基、アシル基、アリール基、アリールカルボニル基であって該アリール基及び該アリールカルボニル基は、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲノメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はモノー若しくはジー低級アルキルアミノ基で置換されていてもよく、アラルキル基であって該アラルキル基は、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲノメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はモノー若しくはジー低級アルキルアミノ基で置換されていてもよい。或は、R<sup>3</sup>が同一炭素原子に結合して、下記式で示される基の場合

【0016】

【化11】



【0017】R<sup>3</sup>は両者一体となりオキソ基又はチオキソ基を意味する。以下同様] 本発明化合物は、安息香酸のp-位又はm-位においてヘテロ環と縮合し二環性若しくは三環性を形成するベンゼン環が酸素原子又は硫黄原子を介して結合している点に化学構造上の特徴を有する新規な化合物である。

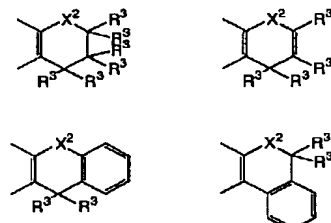
【0018】以下に本発明化合物を更に詳細に説明する。本明細書の一般式の基の定義において、「低級」とは、特に断らない限り、炭素数が1乃至6個の直鎖状又は分岐状の炭素鎖を意味する。

基で置換されていてもよい低級アルキニル基、ハロゲン原子、トリハロゲノメチル基、水酸基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、モノー若しくはジー低級アルキルアミノ基、シクロアルキル基、アリール基、アリールオキシ基、ビスシクロアルキル基で置換されていてもよい基。

A環：下記式で示される基

【0014】

【化10】



【0019】従って、「低級アルキル基」としては、具体的には例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、1,2-ジメチルプロピル基、ヘキシル基、イソヘキシル基等が挙げられ、中でもメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基などのC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、とりわけメチル基、エチル基が好適な基として挙げられる。

【0020】「低級アルケニル基」は炭素数が2乃至6個の直鎖又は分岐状のアルケニル基であり、具体的にはビニル基、アリル基、1-プロペニル基、イソプロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、2-メチル-1-プロペニル基、2-メチルアリル基、1-メチル-1-プロペニル基、1-メチルアリル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、3-メチル-1-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基、3-メチル-3-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、3-メチル-1-ブテニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基等が挙げられ、中でもビニル基、アリル基、各ブテニル基などのC<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>アルケニル基、とりわけビニル基やアリル基などのC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル基が好適である。

【0021】「低級アルキニル基」は、炭素数が2乃至6個の直鎖又は分岐状のアルキニル基であって、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、3-メチル-1-ブチニル基、2-メチル-3-ブチニル基、1

ーメチルー2-ブチニル基、1-メチルー3-ブチニル基、1, 1-ジメチルー2-プロピニル基、1-ヘキシニル基、2-ヘキシニル基、3-ヘキシニル基、4-ヘキシニル基、5-ヘキシニル基等が、好適にはエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、各ブチニル基などのC<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>アルキニル基、至適にはエチニル基が例示される。

【0022】また、「低級アルコキシ基」としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ(アミルオキシ)基、イソペンチルオキシ基、tert-ペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、2-メチルブトキシ基、1, 2-ジメチルプロポキシ基、1-エチルプロポキシ基、ヘキシルオキシ基等が挙げられ、中でもメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基などのC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ基が好ましい。

【0023】「ハロゲン原子」は特に限定されるものではなく、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子など全てのハロゲン原子が挙げられる。「トリハロゲンメチル基」としてはトリフルオロメチル基、トリクロロメチル基等であるが、トリフルオロメチル基が特に好適である。「モノ-若しくはジ-低級アルキルアミノ基」は、アミノ基の一つ又は二つの水素原子が前記低級アルキル基で置換された基を意味する。具体的にはメチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、イソペンチルアミノ基、ヘキシルアミノ基、イソヘキシルアミノ基等モノアルキルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基、ジブチルアミノ基、ジペンチルアミノ基、ジヘキシルアミノ基等ジ置換された対称型のジアルキルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルプロピルアミノ基、エチルプロピルアミノ基、ブチルメチルアミノ基、ブチルエチルアミノ基、ブチルプロピルアミノ基等非対称型のジアルキルアミノ基が挙げられ、中でもメチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基などが好適である。

【0024】「アリール基」としては、フェニル基、ナフチル基、ビフェニル基、アントラセニル基、フェナントレニル基などの単環式、二環式、三環式のアリール基が挙げられ、中でもフェニル基、ナフチル基が好適である。「アラルキル基」は、前記低級アルキル基の任意の1乃至3個の水素原子が前記アリール基で置換された基であって、フェニル基で例示すればベンジル基、フェネチル基、1-フェニルエチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、1-フェニルプロピル基、1-メチルー2-フェニルエチル基、4-フェニルブチル基、2-メチルー3-フェニルプロピル基、5-

フェニルペンチル基、6-フェニルペンチル基、ベンズヒドリル基、トリチル基などが挙げられ、中でもベンジル基、フェネチル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、2-(1-ナフチル)エチル基、2-(2-ナフチル)エチル基、ジフェニルメチル基などが好適である。

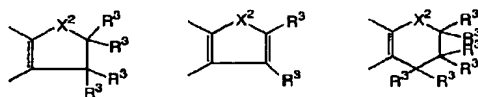
【0025】「シクロアルキル基」としては、具体的にはシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基が挙げられ、中でもシクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基などが好適である。「アリールオキシ基」としては、フェニルオキシ基、ナフチルオキシ基、ビフェニルオキシ基、アントラセニルオキシ基、フェナントレニルオキシ基等の単環式、二環式、三環式のアリール基に酸素原子が結合した基が挙げられ、中でもフェニルオキシ基、ナフチルオキシ基が好適である。「ビスシクロアルキル基」としては、アダマンチル基、デカリン基、ノルボルニル基等が挙げられる。「アシル基」としては、例えば、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、イソバレリル基、ピバロイル基等の低級アルカノイル基、或いはベンゾイル基等のアシル基等であり、より好ましくは、アセチル基、ベンゾイル基である。

【0026】本発明の化合物(I)は、塩基との塩を形成する。また、置換基の種類によっては分子内塩を形成する場合もあり、更に酸との塩を形成する場合もある。本発明にはこれら化合物の製薬学的に許容される塩も含まれ、かかる塩としては、具体的には、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウム、アルミニウムなどの無機塩基、メチルアミン、エチルアミン、エタノールアミン、シクロヘキシルアミンなどの有機塩基、リジン、オルニチンなどの塩基性アミノ酸などの塩基との塩、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、硝酸、リン酸等の鉱酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、シュウ酸、マロン酸、コハク酸、フマル酸、マレイン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、炭酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸等の有機酸、アスパラギン酸、グルタミン酸などの酸性アミノ酸などの酸との酸付加塩やアンモニウム塩等が挙げられる。

【0027】また、化合物(I)やそれらの製薬学的に許容される塩は、置換基の種類によっては、不斉炭素原子の存在に基づく光学異性体、二重結合の存在に基づく幾何異性体、ケト-エノール互変異性体など各種の異性体が存在する。本発明にはこれら異性体の単離されたものやその混合物も包含される。また、本発明の化合物は水和物やエタノールなどの溶媒和物や結晶多形として単離される場合もあり、本発明にはこれらの水和物、溶媒和物や結晶多形の物質も含まれる。本発明化合物において、好ましい化合物としては、特にA環が下記式で示される基である。

【0028】

【化12】



【0029】また、更に好ましくは、 $R^{1a}$ がハロゲン原子であり、 $R^{1b}$ 乃至 $R^{1g}$ が水素原子である化合物であ

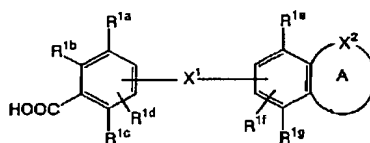
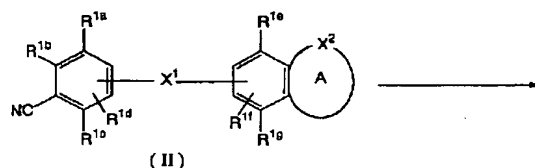
る。

【0030】（化合物の製造法）本発明の化合物（I）乃至（IV）は、その基本骨格あるいは置換基の種類に基づく特徴を利用し、種々の合成法を適用して製造することができる。以下にその代表的な製造法を示す。

第1製法

【0031】

【化13】



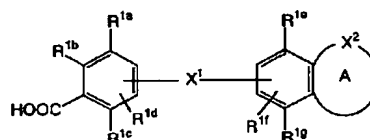
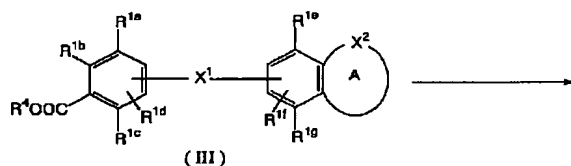
【0032】本発明の医薬化合物（I）は、対応するニトリル化合物（II）を加水分解することにより製造できる。反応は常法によって行うことができ、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の濃アルカリ中、あるいは塩酸、硫酸又はリン酸などの強酸中、加熱、好ましくは加熱還流するのが好ましい。通常溶媒としては、エタノー

ル、メタノール、イソプロパノールなどのアルコール等水と混合する有機溶媒が用いられる。

第2製法

【0033】

【化14】



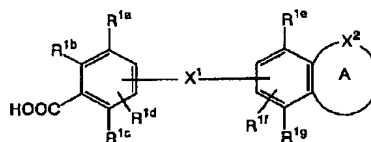
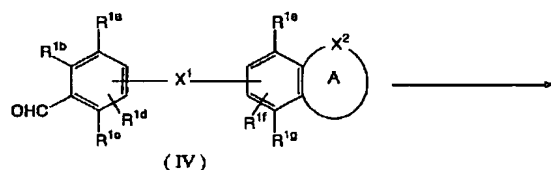
【0034】（式中、 $R^4$ は低級アルキル基又はアラルキル基を意味する。以下同様）本発明の化合物（I）は、対応するエステル化合物（III）をエステル加水分解または加水素分解することによっても製造できる。なお、低級アルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基等を、アラルキル基としては、ベンジル基等カルボン酸製造原料のエステルに通常用いられる基が挙げられる。この加水分解反

応において<sup>(1)</sup>は、炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウム等の塩基又はトリフルオロ酢酸、塩酸等の酸の存在下に加水分解する常法が、また、加水素分解にあつては、パラジウム-炭素、ラネーニッケルなどの触媒の存在下に接触還元する方法などの常法が適用できる。

第3製法

【0035】

【化15】



【0036】本発明の化合物（I）は、対応するアルデヒド化合物（IV）に酸化剤を作用させることによって製造することもできる。用いられる酸化剤としては、硝酸銀、酸化銀、過マンガン酸カリウム、クロム酸、過酸化水素や過安息香酸、*m*-クロロ過安息香酸、過酢酸などの有機過酸が好適である。反応は、酸化物の種類によって異なるが、例えば硝酸銀を用いる場合には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ水溶液中、加熱、好ましくは加熱還流することにより行うことが可能である。この場合、通常溶媒としては、エタノール、メタノール、イソプロパノール等の水と混合し得る有機溶媒が用いられる。また、有機過酸を用いる場合は、クロロホルム、トルエン、メタノール、エタノール等のアルコール、エーテル等の有機溶媒中通常室温下で行われ、過酸化水素を用いる場合は、過酸化水素あるいはこれとメタノール、エタノール等のアルコール、エーテルを加えたものを作用させ、必要ならば加温することによって行われる。過酸化水素を用いるときは、バナジウムやモリブデンなどの金属触媒を用いると効果的な場合もある。

【0037】（その他の製造法）本発明化合物は置換基  $R^1$  乃至  $R^3$  並びに  $X^1$ 、 $X^2$  などの二価基の特徴を勘案して、その変換反応によって製造することもできる。例えば実施例や参考例に記載の方法あるいはこれらの方法に準じて目的物（I）を製造することができる。具体的には例えば、

（1）還元

（a）対応するアルケニル、アルケニレン、アルキニル、アルキニレン化合物をパラジウム炭素などを触媒として接触水素化するアルキル、アルキレン化合物の合成。

（b）対応する芳香環ニトロ化合物をパラジウム炭素などを触媒として接触水化する芳香環アミノ化合物の合成。

（2）エーテル化、チオエーテル化

対応するアルコールやフェノールあるいはチオールやチオフェノールと、対応するハライドを塩基の存在下に反応させるエーテル又はチオエーテル化合物の合成。

（3）加水分解

対応する<sup>(1)</sup>エステル化合物をアルカリけん化、酸性加水分解又は加水素分解するカルボン酸の合成。

（4）アルケンの合成

対応する芳香族アルデヒド化合物に、対応するジエチルホスホン酸エステルやトリフェニルホスフィンなどを反応させるアルケニル、アルケニレン化合物の合成。

【0038】（5）N-アルキル化

対応する一級又は二級アミノ化合物に対応するハライド、スルホネート、アルデヒド、ケトンを反応させる二級又は三級アミノ化合物の合成。

（6）酸化

対応する芳香族アルデヒド化合物を有機過酸や過酸化水素で処理するフェノールの合成。

（7）ニトロ化

対応する芳香環化合物にニトロニウムテトラフルオロボレートなどのニトロ化剤を作用させるニトロ化合物の合成。

など常法を適用して本発明化合物としうる。上記各製法により得られた反応生成物は、遊離化合物、その塩あるいは各種の溶媒和物として単離され、精製される。塩は通常の造塩反応に付すことにより製造できる。単離、精製は、抽出、濃縮、留去、結晶化、濾過、再結晶、各種クロマトグラフィー等通常の化学操作を適用して行われる。

【0039】

【発明の効果】本発明の化合物は、テストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼ阻害活性、特にヒト由来のテストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼに対して良好な阻害活性を有しており、前立腺肥大及びその他の男性ホルモンの作用に起因する種々の疾患、例えば前立腺ガン、脂漏、 $\Delta$ 座 $\nabla$ 瘡、男性型脱毛症の治療に有用である。本発明化合物のテストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼ阻害作用は、以下に示すようにヒト前立腺を用いた5 $\alpha$ -レダクターゼ阻害活性（*in vitro*）の試験により明らかである。以下にその試験方法を掲記する。

【0040】（1）テストステロン 5 $\alpha$ -レダクターゼの調製

良性前立腺肥大症患者より得たヒト前立腺組織に0.3 Mスクロース、1 mMジチオスレイトール、50  $\mu$ M

NADPHを含む10mMトリス-塩酸緩衝液(pH 7.0)を加えポリトンおよびソニファイアーで均質化した後、140000×gで遠心分離した。これによって得た沈殿を10mMトリス-塩酸緩衝液(pH 7.0)で懸濁したものを酵素溶液とした。

【0041】(2) テストステロン 5α-レダクターゼの阻害活性の測定

上記の酵素溶液100μlに、50mMトリス-塩酸緩衝液(pH 5.0)、ジチオスレイトール(最終濃度1mM)、NADPH(最終濃度5mM)、[4-<sup>14</sup>C]-テストステロン(最終濃度1μM, 0.04μCi)および数種類の濃度の本発明化合物を加え総量を500μlとした。この混合液を37℃、60分間インキュベーション後、酢酸エチル2.0mlを加えて酵素反応を停止させ、さらに担体としてテストステロン、ジヒドロテストステロン、4-アンドロスタン-3, 17-ジオン、5α-アンドロスタン-3α, 17β-ジオールを加えた。次いで遠心分離を行い、得られた上清1.0mlを濃縮後シリカゲル薄層クロマトグラフィー(酢酸エチル、シクロヘキサン(1:1)の混合液で展開)を用いて分離された、4-アンドロスタン-3, 17-ジオン、ジヒドロテストステロンおよび5α-アンドロスタン-3α, 17β-ジオールの各スポットを単離して、液体シンチレーションカウンターで各々の放射活性を測定し、下記の式により阻害率を算出した。その結果から50%阻害濃度を求めた。

【0042】

【数1】

$$\text{阻害率 (\%)} = \frac{B/A - B'/A'}{B/A} \times 100$$

【0043】A: TLCにスポットした全放射活性量  
(本発明化合物を加えない場合)

B: ジヒドロテストステロンおよび5α-アンドロスタ

ン-3α, 17β-ジオールの放射活性量の合計(本発明化合物を加えない場合)

A': TLCにスポットした全放射活性量(本発明化合物を加えた場合)

B': ジヒドロテストステロンおよび5α-アンドロスタン-3α, 17β-ジオールの放射活性量の合計(本発明化合物を加えた場合)

本発明化合物はヒト前立腺を用いたテストステロン5α-レダクターゼ阻害活性の試験において極めて高い活性を示すものであり、臨床上的高い有用性が期待できる。

【0044】一般式(I)で示された化合物又はその製薬学的に許容される塩の1種又は2種以上を有効成分として含有する製薬組成物は、通常製剤化に用いられる担体や賦形剤、その他の添加剤を用いて調製される。製剤用の担体や賦形剤としては固体又は液体状の非毒性医薬用物質が挙げられる。これらの例としては、たとえば乳糖、ステアリン酸マグネシウム、スターチ、タルク、ゼラチン、寒天、ペンチン、アラビアゴム、オリーブ油、ゴマ油、カカオバター、エチレングリコール等やその他常用のものが例示される。投与は錠剤、丸剤、カプセル剤、顆粒剤、液剤等による経口投与、あるいは静注、筋注等の注射剤、坐剤、経皮剤等による非経口投与のいずれの形態であってもよい。投与量は症状、投与対象の年齢、性別等を考慮して個々の場合に依りて適宜決定される。経口投与の場合には、通常成分1日当たり、0.001mg~500mg好ましくは0.01~200mgであり、1日1回から数回投与される。又、症状によっては経皮投与される場合は通常1回に0.0001~500mgの範囲で1日1回から数回投与される。但し、投与量は症状などによってさらに少ない量で十分な場合もありこれらの範囲に限定されるものではない。

【0045】(処方例)次に、本発明化合物の医薬としての処方例を挙げる。

処方例1

錠剤	
本発明化合物(I)	20mg
乳糖	57mg
コーンスターチ	38mg
ヒドロキシプロピルセルロース	4mg
マグネシウム ステアレート	1mg
総量	120mg

本発明化合物(I)20g、乳糖57g、コーンスターチ38gを均一に混合する。次に10%ヒドロキシプロピルセルロース溶液40gを加えて湿式造粒する。篩過後、乾燥する。得られた造粒物にマグネシウムステアレ

ート1gを加えて混合する。7m/m5.6Rの臼杵を用いて打錠する。

【0046】処方例2

カプセル	
本発明化合物(I)	15mg
結晶セルロース	40mg
結晶乳糖	144mg
マグネシウム ステアレート	1mg
総量	200mg

本発明化合物(I)15g、結晶セルロース40g、結

晶乳糖144g、マグネシウム ステアレート1gを均



一に混合し、カプセル充填機で3号カプセルに充填しカプセル剤とする。

【0047】

【実施例】次に、実施例により本発明の化合物およびその製造法を具体的に説明する。なお、参考例として、実施例で使用する原料化合物の製造法を説明する。

【0048】参考例1

5-ベンジルオキシ-1H-インドール (13.4 g、60.0 mmol) とジメチルスルホキシド (100 ml) の溶液に撈拌下室温で水酸化カリウム (15.8 g、240 mmol) を一挙に加えた。反応混合物を1時間撈拌した後、室温でベンジルブロミド (10.8 g、63.0 mmol) のジメチルスルホキシド (50 ml) 溶液を滴下し、3時間撈拌した。水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出し、抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣をエタノールで再結晶することにより、1-ベンジル-5-ベンジルオキシ-1H-インドール (16.0 g、51.0 mmol、85%) を灰白色結晶として得た。

【0049】融点 108-109℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>)

δ: 5.08 (s, 2H), 5.26 (s, 2H), 5.45 (d, 1H, J=3.1 Hz), 6.90 (d, 1H, J=8.5, 2.4 Hz), 7.08-7.09 (m, 3H), 7.14 (d, 1H, J=9.2 Hz), 7.17 (d, 1H, J=2.4 Hz), 7.23-7.31 (m, 4H), 7.37 (t, 2H, J=7.3 Hz), 7.45 (d, 2H, J=7.3 Hz)

MS: m/z 313 (M<sup>+</sup>)

【0050】参考例2-8

参考例1と同様にして後記表1に示す参考例2-8の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0051】参考例9

5-ベンジルオキシ-1H-インドール (4.47 g、20.0 mmol) と酢酸 (50 ml) の混合物に室温下シアノ水素化ほう素ナトリウム (3.77 g、60 mmol) を加え、30分間撈拌した。反応混合物を氷水中に注ぎ、反応生成物をジクロロメタンで抽出した。抽出液を5N水酸化ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮して5-ベンジルオキシインドリン (4.19 g、18.6 mmol、93%) を黄色油状物として得た。

NMR (CDCl<sub>3</sub>)

δ: 2.99 (t, 2H, J=8.3 Hz), 3.53 (t, 2H, J=8.3 Hz), 4.98 (s, 2H), 6.57 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.66 (dd, 1H, J=8.3, 2.4 Hz), 7.3-7.5 (5H, m)

MS: m/z 225 (M<sup>+</sup>)

【0052】参考例10

5-ベンジルオキシインドリン (4.17 g、18.5 mmol) とピリジン (20 ml) の混合物に0℃で塩化ベンゾイル (3.94 g、28 mmol) を加え、1時間撈拌した。反応混合物に水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を3N塩酸、水、1N水酸化ナトリウム水溶液、水、および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣を酢酸エチルで再結晶し1-ベンゾイル-5-ベンジルオキシインドリン (5.26 g、16.0 mmol、86%) を無色結晶として得た。

融点 137-138℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>)

δ: 3.08 (t, 2H, J=8.0 Hz), 4.03 (br, 2H), 5.04 (br, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.3-7.6 (m, 12H)

MS: m/z 329 (M<sup>+</sup>)

【0053】参考例11

4-メトキシアニリン (8.00 g、65 mmol) とN,N-ジメチルアニリン (12 ml) の混合物に170℃で2-ブロモアセトフェノン (3.98 g、20.0 mmol) とN,N-ジメチルアニリン (7 ml) の混合物を加え、1時間撈拌した後、放冷した。反応生成物を酢酸エチルで抽出し、抽出液を2N塩酸、水、および飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液: ヘキサン: 酢酸エチル=9:1、次いで4:1) で精製した後、酢酸エチルで再結晶し、5-メトキシ-2-フェニル-1H-インドール (1.62 g、7.26 mmol、36%) を黄色結晶として得た。

融点 170-172℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>)

δ: 3.86 (s, 3H), 6.75 (s, 1H), 6.85 (dd, 1H, J=8.8, 2.4 Hz), 7.09 (s, 1H), 7.2-7.3 (m, 2H), 7.42 (dd, 2H, J=7.8, 7.3 Hz), 7.63 (d, 2H, J=7.8 Hz), 8.22 (br, 1H)

MS: m/z 223 (M<sup>+</sup>)

【0054】参考例12

N-ベンゾイルピロリジン (1.05 g、6.00 mmol) と1,2-ジクロロエタン (6 ml) の混合物に加熱還流下、オキシ塩化りん (2.76 g、18 mmol) を加え40分間撈拌した後、5-ベンジルオキシ-1-メチル-1H-インドール (1.42 g、6.00 mmol) と1,2-ジクロロエタン (4 ml) の混合物を加え加熱還流下6時間撈拌し、放冷した。反応混合

物に水を加え、1 N水酸化ナトリウム水溶液で中和した後、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液：ヘキサン：酢酸エチル＝1：4、次いで2：3）で精製して3-ベンゾイル-5-ベンジルオキシ-1-メチル-1H-インドール（1.33 g、3.90 mmol、65%）を無色結晶として得た。

【0055】融点 91-92℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>)

δ: 3.81 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 7.07 (dd, 1H, J=8.8, 2.4 Hz), 7.26 (s, 1H), 7.32 (t, 1H, J=7.3 Hz), 7.40 (dd, 2H, J=7.8, 6.9 Hz), 7.5-7.6 (m, 5H), 7.80 (d, 2H, J=7.5 Hz), 8.08 (d, 1H, J=2.4 Hz)

MS: m/z 341 (M<sup>+</sup>)

【0056】参考例13

1-ベンゾイル-5-ベンジルオキシインドリン（2.36 g、7.16 mmol）、メタノール（20 ml）、酢酸エチル（100 ml）の混合物に10%パラジウム-炭素（100 mg）を加え、水素雰囲気下、室温で2日間攪拌した。触媒を濾去し、濾液を減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルで再結晶させて、1-ベンゾイル-5-ヒドロキシインドリン（1.58 g、6.60 mmol、92%）を無色結晶として得た。

融点 215-217℃

NMR (DMSO-d<sub>6</sub>)

δ: 2.99 (t, 3H, J=8.3 Hz), 3.94 (br, 2H), 6.59 (br, 1H), 6.68 (s, 1H), 7.4-7.5 (m, 4H), 7.54, 7.90 (各br, 合わせて2H)

MS: m/z 239 (M<sup>+</sup>)

【0057】参考例14

アルゴン雰囲気下、1-ベンジル-5-ヒドロキシインドリン（359 mg、1.50 mmol）、THF（0.30 ml）の混合物に三ふっ化ほう素エーテル錯体（426 mg、3.00 mmol）を加えた後、30分間加熱還流した。反応混合物にボランジメチルスルフィド錯体（0.30 ml、2.0 mmol）を加え、油浴温を100℃に上げ溶媒を1時間で留去した後、6 N塩酸（1 ml）を加え、加熱還流下1時間攪拌した。反応混合物を氷冷し、5 N水酸化ナトリウム水溶液で中和した後、酢酸エチルを加えて反応生成物を抽出した。不溶物を濾去し、抽出液を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液：ヘキサン：酢酸エチル＝9：1、次いで4：1）で精製し

て1-ベンジル-5-ヒドロキシインドリン（221 mg、0.981 mmol、65%）を無色結晶として得た。

【0058】融点 118-119℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>)

δ: 2.90 (br, 2H), 3.23 (br, 2H), 4.15, 4.34 (各br, 合わせて2H), 6.3-6.7 (m, 2H), 7.2-7.4 (m, 6H)

MS: m/z 225 (M<sup>+</sup>)

【0059】参考例15

アルゴン雰囲気下、1-ベンジル-5-ベンジルオキシ-1H-インドール（16.0 g、51.0 mmol）、10%パラジウム-炭素（1.6 g）、エタノール（300 ml）の混合物に、蟻酸アンモニウム（25.7 g、408 mmol）を一挙に加えた。反応混合物を室温下3時間攪拌した後、不溶物を濾去し、減圧下濃縮した。得られた残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を1 N塩酸、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、1-ベンジル-5-ヒドロキシ-1H-インドール（10.9 g、48.9 mmol、96%）を灰白色結晶として得た。

【0060】融点 90-92℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>)

δ: 4.61 (s, 1H), 5.25 (s, 2H), 6.41 (d, 1H, J=2.4 Hz), 6.72 (dd, 1H, J=8.8, 2.4 Hz), 7.03 (d, 1H, J=2.4 Hz), 7.07-7.10 (m, 4H), 7.22-7.30 (m, 3H)

MS: m/z 223 (M<sup>+</sup>)

【0061】参考例16-18

参考例15と同様にして後記表1に示す参考例16-18の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0062】参考例19

アルゴン雰囲気下、5-メトキシ-2-フェニル-1H-インドール（670 mg、3.00 mmol）、ジクロロメタン（5 ml）の混合物に-78℃で三臭化ほう素の1.0 Mジクロロメタン溶液（9.0 ml、9.0 mmol）を加え10分間攪拌した後、室温下で13時間攪拌した。反応混合物を氷水中に注ぎ、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をエタノールで再結晶させて5-ヒドロキシ-2-フェニル-1H-インドール（459 mg、2.19 mmol、73%）を無色結晶として得た。

【0063】融点 236-239℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>)

$\delta$ : 5.33 (s, 2H), 6.53 (d, 1H,  $J=2.9$  Hz), 6.76 (d, 1H,  $J=8.3$  Hz), 6.88 (dd, 1H,  $J=8.8, 2.4$  Hz), 7.12–7.14 (m, 2H), 7.21 (d, 1H,  $J=2.9$  Hz), 7.25–7.37 (m, 6H), 7.71 (d, 1H,  $J=2.0$  Hz)  
MS:  $m/z$  209 ( $M^+$ )

【0064】参考例20

参考例19と同様にして5-ヒドロキシ-2-フェニルベンゾフランを得た。

NMR ( $CDCl_3$ )

$\delta$ : 4.67 (br, 1H), 6.79 (dd, 1H,  $J=8.8, 2.4$  Hz), 6.93 (d, 1H,  $J=1.0$  Hz), 6.99 (d, 1H,  $J=2.4$  Hz), 7.33–7.38 (m, 2H), 7.42–7.46 (m, 2H), 7.83–7.85 (m, 2H)

MS:  $m/z$  210 ( $M^+$ )

【0065】参考例21

1-ベンジル-5-ヒドロキシ-1H-インドール (3.35 g, 15.0 mmol)、3-クロロ-4-フルオロベンズニトリル (2.45 g, 15.8 mmol)、N, N-ジメチルホルムアミド (50 ml) の混合物に、攪拌下室温で炭酸カリウム (3.11 g, 22.5 mmol) を一挙に加えた。反応混合物を80℃で7時間攪拌した後、放冷した。水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出し、抽出液を1N水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、4-[(1-ベンジル-1H-インドール-5-イル) オキシ]-3-クロロベンズニトリル (5.67 g, 15.0 mmol, 100%) を褐色油状物として得た。

【0066】NMR ( $CDCl_3$ )

$\delta$ : 5.33 (s, 2H), 6.53 (d, 1H,  $J=2.9$  Hz), 6.76 (d, 1H,  $J=8.3$  Hz), 6.88 (dd, 1H,  $J=8.8, 2.4$  Hz), 7.12–7.14 (m, 2H), 7.21 (d, 1H,  $J=2.9$  Hz), 7.25–7.37 (m, 6H), 7.71 (d, 1H,  $J=2.0$  Hz)

MS:  $m/z$  358 ( $M^+$ )

【0067】参考例22-31

参考例21と同様にして後記表1に示す参考例22-31の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0068】参考例32

6-ヒドロキシフラボン (1.19 g, 5.00 mmol)、3, 4-ジクロロベンズアルデヒド (880 mg, 5.00 mmol)、ジメチルスルホキシド (10 ml) の混合物に攪拌下室温で炭酸カリウム (1.04 g, 7.50 mmol) を一挙に加えた。反応混合物を

100℃で17時間攪拌した後、放冷した。水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出し、抽出液を水、1N水酸化ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣をアセトンで洗浄することにより、3-クロロ-4-[(4-オキシ-2-フェニル-4H-クロメン-6-イル) オキシ] ベンズアルデヒド (540 mg, 1.43 mmol, 29%) を茶褐色結晶として得た。

【0069】融点 188–189℃

NMR ( $DMSO-d_6$ )

$\delta$ : 7.09 (s, 1H), 7.29 (d, 1H,  $J=8.3$  Hz), 7.51 (d, 1H,  $J=3.0$  Hz), 7.58–7.66 (m, 3H), 7.71 (dd, 1H,  $J=9.3, 3.0$  Hz), 7.91 (dd, 1H,  $J=8.3, 2.0$  Hz), 7.95 (d, 1H,  $J=9.3$  Hz), 8.13–8.18 (m, 3H), 9.97 (s, 1H)

MS:  $m/z$  376 ( $M^+$ )

【0070】参考例33

参考例32と同様にして4-(2-ジベンゾフラニルオキシ) ベンズアルデヒドを得た。

NMR ( $CDCl_3$  中、TMS内部標準)

$\delta$ : 7.08 (2H, m), 7.21 (1H, m), 7.34 (1H, m), 7.49 (2H, m), 7.59 (2H, m), 7.67 (1H, d), 7.8–7.9 (3H, m), 9.92 (1H, m)

MS:  $m/z$  288 ( $M^+$ )

【0071】参考例34

3-ベンゾイル-5-ベンジルオキシ-1-メチル-1H-インドール (478 mg, 1.40 mmol)、エタノール (3 ml)、酢酸エチル (10 ml)、酢酸 (3 ml) の混合物に、10%パラジウム-炭素 (50 mg) を加え、水素雰囲気下、室温で2日間攪拌した。触媒を濾去し、濾液を減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液: ヘキサン: 酢酸エチル=4:1) で精製して、3-ベンジル-5-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インドール (155 mg, 0.653 mmol, 47%) を黄色油状物として得た。

NMR ( $CDCl_3$ )

$\delta$ : 3.69 (s, 3H), 4.03 (s, 2H), 6.74 (s, 1H), 6.78 (dd, 1H,  $J=8.3, 2.4$  Hz), 6.88 (d, 1H,  $J=2.4$  Hz), 7.1–7.3 (m, 6H)

MS:  $m/z$  237 ( $M^+$ )

【0072】参考例35

アルゴン雰囲気下、2-ヒドロキシ-5-メトキシベンズアルデヒド (760 mg, 5.00 mmol)、 $\alpha$ -ブロモフェニル酢酸 (1.80 g, 5.00 mmol)、N, N-ジメチルホルムアミド (10 ml) の混

合物に攪拌下室温で60%水酸化ナトリウム(460mg、11.5mmol)を少しずつ5分間かけて加えた。反応混合物を室温で23時間攪拌した後、反応生成物を水で抽出し、抽出液をクロロホルムで洗浄し、1N塩酸でpH<3に調整した。トルエンを加え、得られた有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;クロロホルム:メタノール:酢酸=95:4.5:0.5)で精製して、 $\alpha$ -[(2-ホルミル-4-メトキシ)フェノキシ]フェニル酢酸(560mg、1.96mmol、39%)を褐色油状物として得た。

【0073】NMR(CDCl<sub>3</sub>)

$\delta$ : 3.80 (s, 3H), 5.64 (s, 1H), 6.86 (d, 1H, J=9.3Hz), 7.04-7.07 (m, 1H), 7.32 (d, 1H, J=3.4Hz), 7.38-7.45 (m, 3H), 7.56-7.57 (m, 2H), 10.45 (s, 1H)

MS: m/z 286 (M<sup>+</sup>)

【0074】参考例36

トリエチルアミン(710mg、7.00mmol)、p-トルエンスルホンクロリド(670mg、3.50mmol)、トルエン(12ml)の混合物に、加熱還流下 $\alpha$ -[(2-ホルミル-4-メトキシ)フェノキシ]フェニル酢酸(500mg、1.75mmol)のトルエン(15ml)溶液を滴下した。反応混合物を加熱還流下4時間攪拌した後、放冷し、減圧下濃縮した。得られた残渣にトルエン(5ml)と1N水酸化ナトリウム水溶液(20ml)を加え、室温下15時間攪拌した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣をエタノールで再結晶することにより、5-メトキシ-2-フェニルベンゾフラン(100mg、0.45mmol、26%)を褐色結晶として得た。

【0075】融点 130-131°C

NMR(CDCl<sub>3</sub>)

$\delta$ : 3.85 (s, 3H), 6.88 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 6.96 (s, 1H), 7.04 (d, 1H, J=2.4Hz), 7.34 (t, 1H, J=7.3Hz), 7.39-7.46 (m, 3H), 7.83-7.85 (m, 2H)

MS: m/z 224 (M<sup>+</sup>)

【0076】参考例37

アルゴン雰囲気下、5-ベンジルオキシ-1H-インドール(6.03g、27.0mmol)、THF(50ml)の溶液に攪拌下-78°Cでn-ブチルリチウムのヘキサン溶液(18.8ml、1.6M、30mmol)を加え、室温下で15分間攪拌した後、反応混合物を-78°Cに再冷却した。ベンゼンスルホンクロリド(3.8ml、30mmol)を加え、-78°Cで1時

間、続いて室温下で3.5時間攪拌した。反応混合物に水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ジクロロメタン:ヘキサン=1:3)で精製して、1-ベンゼンスルホンル-5-ベンジルオキシ-1H-インドール(4.73g、13.0mmol、48%)を黄色油状物として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0077】参考例38

n-ブチルリチウム(4.4mmol)とジイソプロピルアミン(4.4mmol)とから調製したリチウムジイソプロピルアミドのTHF(4ml)溶液に、アルゴン雰囲気下-78°Cで、1-ベンゼンスルホンル-5-ベンジルオキシ-1H-インドール(1.45g、4.00mmol)のTHF(4ml)溶液を加えた後、-20°Cで0.5時間攪拌した。反応混合物を-78°Cに再冷却した後、ベンズアルデヒド(0.45ml、4.4mmol)を加え、-78°Cで10分間、次に0°Cで1.5時間攪拌した。反応混合物に1N塩酸を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で精製して、5-ベンジルオキシ-1-ベンゼンスルホンル-2-( $\alpha$ -ヒドロキシベンジル)-1H-インドール(1.44g、2.90mmol、77%)を黄色油状物として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0078】参考例39

アルゴン雰囲気下、1-ベンゼンスルホンル-5-ベンジルオキシ-1H-インドール(1.35g、3.7mmol)、THF(7ml)の溶液に攪拌下-78°Cでn-ブチルリチウムのヘキサン溶液(2.8ml、1.6M、4.4mmol)を加えた。氷冷下で10分間攪拌した後、反応混合物を-78°Cに再冷却した。塩化ベンゾイル(1.4ml、11.0mmol)を加え、-78°Cで10分間、続いて氷冷下で20分間攪拌した。反応混合物を氷水中に注ぎ、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を1N水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた油状物にエタノール(20ml)および5N水酸化ナトリウム水溶液(6ml)を加え、60°Cで3日間加熱攪拌した後、室温まで放冷した。反応混合物に水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を、1N水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチル/エタノールで再結晶させて2-ベンゾイル-5-ベンジルオキシ-1H-インドール(719mg、2.2

0 mmol、59%)を黄色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0079】参考例40

1-ベンゼンスルホニル-5-ベンジルオキシ-2-( $\alpha$ -ヒドロキシベンジル)-1H-インドール(540 mg、1.15 mmol)とエタノール(5 ml)の混合物に5 N水酸化ナトリウム水溶液(1 ml)を加え、室温下7時間撹拌した。反応混合物に1 N塩酸を加えて中和した後、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ヘキサン:酢酸エチル=97:3)で精製して、5-ベンジルオキシ-1-tert-ブトキシカルボニル-1H-インドール(224 mg、1.00 mmol、87%)を黄色油状物として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0080】参考例41

4-イソプロピルフェニル メチル ケトン(1.62 g、9.99 mmol)、ジクロロメタン(12 ml)、メタノール(4.8 ml)混合物に撹拌下室温でフェニルトリメチルアンモニウム トリプロミド(4.14 g、11.0 mmol)を一挙に加えた。反応混合物を室温で10時間撹拌した後、水を加え、反応生成物をクロロホルムで抽出し、抽出液を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ヘキサン:エーテル=98:2)で精製して、プロモメチル 4-イソプロピルフェニル ケトン(1.65 g、6.84 mmol、68%)を淡黄色油状物として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0081】参考例42

アルゴン雰囲気下、加熱還流させた4-メトキシアニリン(2.02 g、16.4 mmol)とN,N-ジメチルアニリン(3 ml)の混合物に撹拌下プロモメチル 4-イソプロピルフェニル ケトン(1.32 g、5.47 mmol)とN,N-ジメチルアニリン(3 ml)の混合物を滴下し、油浴温度を170℃に保って3時間撹拌した。反応混合物を放冷し酢酸エチルで希釈した後、1 N塩酸を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を1 N塩酸、水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ヘキサン:エーテル=9:1)で精製した後、エタノールから再結晶することにより、2-(4-イソプロピルフェニル)-5-メトキシ-1H-インドール(0.528 g、1.99 mmol、36%)を淡黄色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0082】参考例43

5-ベンジルオキシインドール(2.23 g、10.0 mmol)、tert-ブチル ジ炭酸エステル(2.62 g、12.0 mmol)、アセトニトリル(20 ml)の混合物に撹拌下室温で4-ジメチルアミノピリジン(120 mg、1.00 mmol)を一挙に加えた。反応混合物を室温で3時間撹拌した後、水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;ヘキサン:酢酸エチル=97:3)で精製して、5-ベンジルオキシ-1-tert-ブトキシカルボニル-1H-インドール(2.86 g、8.85 mmol、89%)を無色油状物として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0083】参考例44

4-[(2-ベンジル-1H-インドール-5-イル)オキシ]-3-クロロベンゾニトリル(115 mg、0.320 mmol)、ヨウ化メチル(228 mg、1.00 mmol)、DMSO(1.5 ml)の混合物に水酸化カリウム(90 mg、1.6 mmol)を加え室温下1時間撹拌した。反応混合物に水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮して4-[(2-ベンジル-1-メチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]-3-クロロベンゾニトリル(116 mg、0.311 mmol、97%)を無色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0084】参考例45-78

参考例44と同様にして後記表1に示す参考例45-78の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0085】参考例79

粉碎した水酸化カリウム(502 mg、8.96 mmol)、DMSO(8 ml)の混合物に撹拌下室温で3-クロロ-4-[(1H-インドール-5-イル)オキシ]ベンゾニトリル(600 mg、2.24 mmol)を一挙に加えた。反応混合物を室温で40分撹拌した後、シクロペンチルメチル p-トルエンスルホナート(285 mg、1.12 mmol)、DMSO(1.5 ml)の混合物を室温で滴下した。反応混合物を室温で1時間、50℃で5時間撹拌した後、放冷し、水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;クロロホルム)で精製した後、エタノールから再結晶することにより、3-クロロ-4-[(1-シクロペンチルメチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]ベンズアミド(104 mg、0.282 mmol、25%)を無色結晶として得た。

この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0086】参考例80

5-ベンジルオキシ-1-エトキシカルボニル-1H-インドール (5.38 g, 18.2 mmol) のエタノール (80 ml) 溶液に、10%パラジウム-炭素 (540 mg) を加え、水素雰囲気下室温で6時間攪拌した。触媒を濾去し、得られた濾液を減圧下濃縮することにより、1-エトキシカルボニル-5-ヒドロキシインドリン (3.72 g, 18.0 mmol, 98%) を無色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0087】参考例81

参考例80と同様にして後記表1に示す参考例81の化合物を得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0088】参考例82

5-ベンジルオキシ-1-(4-イソブチルベンジル)-1H-インドール (19.8 g, 53.6 mmol)、10%パラジウム-炭素 (1.98 g) のエタノール (300 ml) 溶液に、蟻酸アンモニウム (27.0 g, 429 mmol) を室温下一挙に加え、室温で10時間攪拌した。触媒を濾去し、濾液を減圧下濃縮し、得られた残渣を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、5-ヒドロキシ-1-(4-イソブチルベンジル)-1H-インドール (14.7 g, 52.8 mmol, 98%) を灰白色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0089】参考例83-92

参考例82と同様にして後記表1に示す参考例83-92の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0090】参考例93

1-(4-ビフェニルメチル)-5-メトキシ-2-メチル-1H-インドール (980 mg, 3.00 mmol) に48%臭化水素酸 (10 ml) を加え、加熱還流下4時間攪拌した。放冷後反応混合物を氷水中に注ぎ、炭酸カリウムで中和し、酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水流酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液; ヘキサン: 酢酸エチル=4:1) で精製し、更にエタノールから再結晶することにより、1-(4-ビフェニルメチル)-5-ヒドロキシ-2-メチル-1H-インドール (290 mg, 0.93 mmol, 31%) を無色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0091】参考例94

アルゴン雰囲気下、2-ベンゾイル-5-ベンジルオキシ-1H-インドール (668 mg, 2.04 mmol)、ジクロロメタン (6 ml) の混合物に0℃で三臭

化ほう素の1.0Mジクロロメタン溶液 (6.1 ml, 6.1 mmol) を加え30分間攪拌した。反応混合物を氷水中に注ぎ、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液; ヘキサン: 酢酸エチル=4:1、次に3:2) で精製した後、クロロホルムから再結晶させて、2-ベンゾイル-5-ヒドロキシ-1H-インドール (380 mg, 1.06 mmol, 79%) を無色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0092】参考例95-96

参考例94と同様にして後記表1に示す参考例95-96の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0093】参考例97

2-ベンジル-5-ヒドロキシ-1H-インドール (215 mg, 0.963 mmol)、3-クロロ-4-フルオロベンゾニトリル (155 mg, 1.00 mmol)、炭酸カリウム (207 mg, 1.5 mmol)、N,N-ジメチルホルムアミド (1.5 ml) の混合物を、60℃で8時間攪拌した。放冷後、反応混合物に水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液; ヘキサン: 酢酸エチル=9:1、次に6:1) で精製して、4-[(2-ベンジル-1H-インドール-5-イル) オキシ]-3-クロロベンゾニトリル (202 mg, 0.563 mmol, 58%) を無色油状物として得た。

【0094】参考例98-116

参考例97と同様にして後記表1に示す参考例98-116の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表1に示す。

【0095】参考例117

N-ベンゾイルピロリジン (210 mg, 1.20 mmol) と1,2-ジクロロエタン (1.5 ml) の混合物に加熱還流下、オキシ塩化りん (0.335 ml, 3.60 mmol) を加え40分間攪拌した後、3-クロロ-4-[(1-メチル-1H-インドール-5-イル) オキシ]ベンゾニトリル (339 mg, 1.20 mmol) と1,2-ジクロロエタン (1 ml) の混合物を加え加熱還流下14時間攪拌し放冷した。反応混合物に1N水酸化ナトリウム水溶液を加え中和した後、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液; ヘキサン: 酢酸エチル=4:1、次に3:2) で精製して4-[(3-ベンゾイル-1-メチル-1H-インドール-5-イル) オキシ]-3-

クロロベンゾニトリル (91 mg、0.235 mmol、20%) を無色油状物として得た。この化合物の理化学的性状を後記表 1 に示す。

【0096】参考例 118

3-クロロ-4-[(5-インドリニル) オキシ] 安息香酸 (870 mg、3.00 mmol) のエタノール (20 ml) 溶液に濃硫酸 (2 ml) を加え、加熱還流下 12 時間撹拌した。反応混合物を放冷後氷水に注ぎ、5 N 水酸化ナトリウム水溶液で中和した。反応生成物を酢酸エチルで抽出し、抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液; ヘキサン: 酢酸エチル = 3: 1) で精製して、エチル 3-クロロ-4-[(5-インドリニル) オキシ] ベンゾエート (940 mg、2.95 mmol、99%) を無色油状物として得た。この化合物の理化学的性状を後記表 1 に示す。

【0097】参考例 119

3-クロロ-4-[(1-tert-ブトキシカルボニル-5-インドリニル) オキシ] ベンゾニトリル (9.19 g、23.5 mmol) にトリフルオロ酢酸 (100 ml) を加え、室温で 1 時間撹拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を 1 N 水酸化ナトリウム水溶液、水及び飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣をエタノールから再結晶することにより、3-クロロ-4-[(5-インドリニル) オキシ] ベンゾニトリル (6.07 g、22.4 mmol、81%) を黄褐色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表 1 に示す。

【0098】参考例 120

エチル 3-クロロ-4-[(5-インドリニル) オキシ] ベンゾエート (320 mg、1.01 mmol)、臭化ベンズヒドリル (300 mg、1.21 mmol)、ヨウ化カリウム (30.0 mg、0.18 mmol)、N,N-ジメチルホルムアミド (5 ml) の混合物に撹拌下室温で炭酸カリウム (210 mg、1.51 mmol) を一挙に加えた。反応混合物を室温で 4 時間撹拌した後、水を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液; ヘキサン: 酢酸エチル = 95: 5) で精製して、エチル 4-[(1-ベンズヒドリル-5-インドリニル) オキシ] -3-クロロベンゾエート (370 mg、0.76 mmol、76%) を無色油状物として得た。この化合物の理化学的性状を後記表 1 に示す。

【0099】参考例 121-129

参考例 120 と同様にして後記表 1 に示す参考例 121-129 の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性

状を後記表 1 に示す。

【0100】参考例 130

3-クロロ-4-[(5-インドリニル) オキシ] ベンゾニトリル (540 mg、2.00 mmol)、シクロヘキサンカルボキシアルデヒド (240 mg、2.10 mmol)、酢酸 (1.20 g、20.0 mmol)、塩化メチレン (20 ml) の混合物に撹拌下室温で水素化トリアセトキシほう素ナトリウム (640 mg、3.00 mmol) を一挙に加えた。反応混合物を室温で 1 時間撹拌した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を炭酸カリウムで中和し、酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣をエタノールで洗浄することにより、3-クロロ-4-[(1-シクロヘキシルメチル-5-インドリニル) オキシ] ベンゾニトリル (650 mg、1.77 mmol、89%) を無色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表 1 に示す。

【0101】参考例 131-137

参考例 130 と同様にして後記表 1 に示す参考例 131-137 の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表 1 に示す。

【0102】参考例 138

参考例 120 と同様にして後記表 1 に示す参考例 138 の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表 1 に示す。

【0103】実施例 1

4-[(1-ベンジル-1H-インドール-5-イル) オキシ] -3-クロロベンゾニトリル (5.66 g、15.8 mmol) のエタノール (50 ml) 溶液に、8 N 水酸化カリウム水溶液 (50 ml) を室温下一挙に加え、3 時間加熱還流下撹拌した。放冷後減圧下濃縮し、10% 塩酸で pH < 3 に調整した。反応生成物を酢酸エチルで抽出し、抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣をエタノール: ヘキサン = 1: 1 の混合溶媒で再結晶することにより、4-[(1-ベンジル-1H-インドール-5-イル) オキシ] -3-クロロ安息香酸 (3.53 g、9.34 mmol、59%) を褐色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表 2 に示す。

【0104】実施例 2-14

実施例 1 と同様にして後記表 2 に示す実施例 2-14 の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表 2 に示す。

【0105】実施例 15

3-クロロ-4-[(4-オキソ-2-フェニル-4H-クロメン-6-イル) オキシ] ベンズアルデヒド (510 mg、1.35 mmol)、硝酸銀 (480 mg、2.84 mmol)、水 (10 ml)、エタノール (1

0 ml)、N、N-ジメチルホルムアミド(10 ml)の混合物に、攪拌下室温で水酸化ナトリウム(220 mg、5.40 mmol)を一挙に加えた。反応混合物を加熱還流下6時間攪拌した後、氷冷下1 N塩酸でpH<4に調整し、不溶物を濾去した。反応生成物を酢酸エチルで抽出し、抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣をエタノールで洗浄することにより、3-クロロ-4-[(4-オキソ-2-フェニル-4H-クロメン-6-イル)オキシ]安息香酸(190 mg、0.48 mmol、36%)を灰白色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0106】実施例16

実施例15と同様にして実施例16の化合物を得た。この化合物の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0107】実施例17

3-クロロ-4-[(1-メチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]ベンズニトリル(198 mg、0.70 mmol)とエタノール(3 ml)の混合物に8 N水酸化ナトリウム水溶液(1 ml)を加え加熱還流下14時間攪拌した。反応混合物を放冷し、減圧下濃縮した後、1 N塩酸で中和し、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣をエタノールで再結晶させて3-クロロ-4-[(1-メチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]安息香酸(157 mg、0.520 mmol、74%)を茶色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0108】実施例18-55

実施例17と同様にして後記表2に示す実施例18-55の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0109】実施例56

アルゴン雰囲気下、粉碎した水酸化カリウム(156 mg、2.78 mmol)とジメチルスルホキシド(4 ml)の混合物に攪拌下室温で3-クロロ-4-[(1H-インドール-5-イル)オキシ]安息香酸(200 mg、0.695 mmol)を一挙に加えた。反応混合物を室温で40分間攪拌した後、4-フェノキシベンジルブロミド(274 mg、1.04 mmol)とジメチルスルホキシド(1.5 ml)の混合物を室温で滴下した。反応混合物を室温で2時間攪拌した後、1 N塩酸を加え、反応生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣をエタノールから再結晶することにより、3-クロロ-4-[[1-(4-フェノキシベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸(240 mg、0.511 mmol、73%)を無色結晶として得た。この化合物

の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0110】実施例57

実施例56と同様にして後記表2に示す実施例57の化合物を得た。この化合物の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0111】実施例58-61

実施例17と同様にして後記表2に示す実施例58-61の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0112】実施例62

エチル 4-[(1-ベンズヒドリル-5-インドリニル)]-3-クロロベンゾエート(350 mg、0.72 mmol)、ジオキサン(1.5 ml)、エタノール(4 ml)の混合物に攪拌下室温で5 N水酸化ナトリウム水溶液(5 ml)を一挙に加えた。反応混合物を室温で2時間攪拌した後、10%塩酸で中和した。反応生成物を酢酸エチルで抽出し、抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた結晶性残渣をエーテル-ヘキサンで再沈澱させることにより、4-[(1-ベンズヒドリル-5-インドリニル)オキシ]-3-クロロ安息香酸(150 mg、0.32 mmol、46%)を灰白色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0113】実施例63、64

実施例62と同様にして後記表2に示す実施例63、64の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0114】実施例65

3-クロロ-4-(5-インドリニルオキシ)安息香酸(580 mg、2.00 mmol)、4-イソプロピルベンズアルデヒド(330 mg、2.20 mmol)、酢酸(120 mg、2.00 mmol)、ジクロロエタン(20 ml)の混合物に攪拌下室温で水素化トリアセトキシほう素ナトリウム(640 mg、3.00 mmol)を一挙に加えた。反応混合物を室温で3時間攪拌した後、水を加え、1 N水酸化ナトリウム水溶液で中和し、酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液;クロロホルム:メタノール=95:5)で精製することにより、3-クロロ-4-[[1-(4-イソプロピルベンジル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸(760 mg、1.80 mmol、90%)を無色結晶として得た。この化合物の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0115】実施例66-68

実施例65と同様にして後記表2に示す実施例66-68の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表2に示す。

#### 【0116】実施例69-84



実施例 17 と同様にして後記表 2 に示す実施例 69-84 の化合物を得た。これらの化合物の理化学的性状を後記表 2 に示す。

【0117】本発明化合物のうち、好ましい化合物を表 3 に例示する。これらの化合物は、前述の製法並びに実

施例として示した方法と同様の方法により製造することができる。

【0118】

【表 1】

表 1

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
2	1-ベンジル-6- ベンジルオキシ-1 H-インドール	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 5.03(s, 2H), 5.22(s, 2H), 6.47(m, 1H), 6.81(d, 1H, J=2.0Hz), 6.84-6.87(m, 1H), 7.01 (d, 1H, J=8.4Hz), 7.07-7.08(m, 2H), 7.23-7.37 (m, 6H), 7.40-7.43(m, 2H), 7.51(d, 1H, J=8.8Hz) MS: m/z 313(M <sup>+</sup> )
3	5-ベンジルオキシ -1-(4-トリフ ルオロメチルフェニ ル)-1H-インド ール	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 5.13(s, 2H), 6.53(d, 1H, J=2.5Hz), 6.98 (dd, 1H, J=9.3, 2.4Hz), 7.21(d, 1H, J=2.4Hz), 7.31-7.41(m, 4H), 7.47-7.51(m, 3H), 7.59(d, 2H, J=8.3Hz), 7.75(d, 2H, J=8.3Hz) MS: m/z 367(M <sup>+</sup> )
4	5-ベンジルオキシ -1-(4-トリフ ルオロメチルベンジ ル)-1H-インド ール	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 5.09(s, 2H), 5.31(m, 2H), 6.48(d, 1H, J= 2.9Hz), 6.91(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.01-7.09 (m, 2H), 7.14(d, 2H, J=7.8Hz), 7.19(d, 1H, J= 2.4Hz), 7.28-7.32(m, 1H), 7.35-7.39(m, 2H), 7.45(d, 2H, J=6.8Hz), 7.52(d, 2H, J=7.8Hz) MS: m/z 381(M <sup>+</sup> )
5	3-クロロ-4- [(9-メチル-9 H-カルバゾール- 2-イル)オキシ] ベンゾニトリル	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 3.85(s, 3H), 6.97-7.00(m, 2H), 7.24(t, 1H, J=5.9Hz), 7.46-7.50(m, 2H), 7.60(d, 1H, J= 7.8Hz), 7.76(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.17(d, 1H, J=7.3Hz), 8.23-8.25(m, 2H) MS: m/z 332(M <sup>+</sup> )
6	4-[(9-ベンジ ル-9H-カルバゾ ール-2-イル)オ キシ]-3-クロロ ベンゾニトリル	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 3.65(s, 3H), 6.96-7.01(m, 2H), 7.15- 7.17(m, 2H), 7.19-7.29(m, 4H), 7.41-7.45(m, 1H), 7.54(d, 1H, J=2.0Hz), 7.62(d, 1H, J=8.3 Hz), 7.75(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 8.19(d, 1H, J= 7.8Hz), 8.21(d, 1H, J=2.0Hz), 8.26(d, 1H, J= 8.3Hz) MS: m/z 408(M <sup>+</sup> )
7	3-クロロ-4- [(1-メチル-2- フェニル-1H- インドール-5-イ ル)オキシ]ベンゾ ニトリル	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 3.78(s, 3H), 6.55(s, 1H), 6.78(d, 1H, J= 8.8Hz), 6.98(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.3-7.6 (m, 8H), 7.74(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 358(M <sup>+</sup> )
8	5-ベンジルオキシ -1-メチル-1H- インドール	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 3.76(s, 3H), 5.10(m, 2H), 6.38(d, 1H, J= 2.9Hz), 6.97(dd, 1H, J=8.8, 2.5Hz), 7.01(d, 1H, J=2.5Hz), 7.16(d, 1H, J=2.5Hz), 7.21(d, 1H, J=8.8Hz), 7.31(t, 1H, J=7.3Hz), 7.38(dd, 2H, J=6.8, 8.8Hz), 7.47(d, 2H, J=7.3Hz) MS: m/z 237(M <sup>+</sup> )

【0119】

【表 2】

表1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
15	5-ヒドロキシ-1- -(4-トリフルオ ロメチルフェニル) -1 H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 4.93(br, 1H), 6.59(d, 1H, J=3.4Hz), 6.82 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.09(d, 1H, J=2.4Hz), 7.31(d, 1H, J=3.4Hz), 7.44(d, 1H, J=8.8Hz), 7.68(d, 2H, J=8.8Hz), 7.75(d, 2H, J=8.8Hz) MS: m/z 277(M <sup>+</sup> )
17	5-ヒドロキシ-1- -(4-トリフルオ ロメチルベンジル) -1 H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.32(s, 2H), 6.45(d, 1H, J=2.9Hz), 6.74 (dd, 1H, J=8.6, 2.4Hz), 7.02-7.10(m, 3H), 7.15 (d, 2H, J=8.3Hz), 7.53(d, 2H, J=7.8Hz) MS: m/z 291(M <sup>+</sup> )
18	1-ベンジル-6- ヒドロキシ-1 H- インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.19(s, 2H), 6.46(d, 1H, J=3.9Hz), 6.64- 6.67(m, 2H), 7.00(d, 1H, J=3.4Hz), 7.07(d, 2H, J=6.4Hz), 7.21-7.33(m, 3H), 7.45(d, 1H, J=8.8 Hz) MS: m/z 223(M <sup>+</sup> )
22	3-クロロ-4- -[1-(4-トリ フルオロメチルフェ ニル)-1 H-イン ドール-5-イル] オキシ]ベンゾニ トリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 6.72-6.73(m, 1H), 6.81(d, 1H, J=8.8Hz), 7.00(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.38-7.44(m, 3H), 7.60(d, 1H, J=9.3Hz), 7.64(d, 2H, J=8.3Hz), 7.75(d, 1H, J=2.0Hz), 7.81(d, 2H, J=8.3Hz) MS: m/z 412(M <sup>+</sup> )
23	3-クロロ-4- -[1-(4-トリ フルオロメチルベン ジル)-1 H-イン ドール-5-イル] オキシ]ベンゾニ トリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.41(s, 2H), 6.57(d, 1H, J=3.4Hz), 6.77 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.90(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.20-7.29(m, 4H), 7.35-7.39(m, 2H), 7.57(d, 2H, J=8.3Hz), 7.72(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 426(M <sup>+</sup> )
24	4-[1-(1-ベンジ ル-1 H-インドー ル-6-イル)オキシ] -3-クロロベン ゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.27(s, 2H), 6.57-6.58(m, 1H), 6.73(d, 1H, J=8.8Hz), 6.83(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.00 (d, 1H, J=2.0Hz), 7.07-7.09(m, 2H), 7.18(d, 1H, J=3.0Hz), 7.24-7.35(m, 4H), 7.65(d, 1H, J= 8.3Hz), 7.71(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 358(M <sup>+</sup> )
25	3-クロロ-4- -[2-フェニルベ ンゾフラン-5-イ ル]オキシ]ベンゾ ニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 6.82(d, 1H, J=8.8Hz), 6.99-7.02(m, 2H), 7.27(d, 1H, J=2.4Hz), 7.37-7.49(m, 4H), 7.55 (d, 1H, J=8.8Hz), 7.76(d, 1H, J=2.0Hz), 7.86- 7.88(m, 2H) MS: m/z 345(M <sup>+</sup> )

【0120】

【表3】

表1 (つづき)

参考例 番号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
26	4-[(1-ベンジ ルインドリン-5- イル)オキシ]-3- クロロベンゾニ トリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.98 (t, 2H, J=8.3Hz), 3.38 (t, 2H, J=8.3 Hz), 4.28 (s, 2H), 6.46 (d, 1H, J=8.5Hz), 6.7- 6.8 (m, 4H), 7.2-7.4 (m, 6H), 7.70 (s, 1H) MS: m/z 360 (M <sup>+</sup> )
27	4-[(1-ベンジ ル-1H-インドー ル-5-イル)オキ シ]ベンゾニトリ ル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.34 (s, 2H), 6.53 (d, 1H, J=9.4Hz), 6.88 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 6.96 (dd, 2H, J=6.8, 2.0 Hz), 7.14 (d, 2H, J=6.8Hz), 7.2-7.4 (m, 6H), 7.55 (m, 2H) MS: m/z 324 (M <sup>+</sup> )
28	4-[(1-ベンジ ル-1H-インドー ル-5-イル)オキ シ]-3-フルオロ ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.34 (s, 2H), 6.53 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.84 (t, 1H, J=8.3Hz), 6.90 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.1-7.4 (m, 9H), 7.44 (dd, 1H, J=10.2, 1.9Hz) MS: m/z 342 (M <sup>+</sup> )
29	4-[(3-ベンジ ル-1-メチル- 1H-インドール- 5-イル)オキシ]- 3-クロロベン ゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 3.76 (s, 3H), 4.04 (s, 2H), 6.70 (d, 1H, J= 8.8Hz), 6.84 (s, 1H), 6.93 (dd, 1H, J=8.8, 2.4 Hz), 7.2-7.4 (m, 8H), 7.71 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 372 (M <sup>+</sup> )
30	3-クロロ-4- [(2-フェニル- 1H-インドール- 5-イル)オキシ] ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 6.80-6.82 (m, 2H), 6.93 (dd, 1H, J=8.5, 2.2Hz), 7.3-7.5 (m, 5H), 7.67 (d, 2H, J=6.9Hz), 7.74 (d, 1H, J=1.9Hz), 8.46 (br, 1H) MS: m/z 344 (M <sup>+</sup> )
31	4-(9H-カルバ ゾール-2-イルオ キシ)-3-クロロ ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 8.94 (dd, 1H, J=17.1, 8.6Hz), 7.02 (d, 1H, J=9.2Hz), 7.18 (t, 1H, J=7.4Hz), 7.22 (d, 1H, J= 1.8Hz), 7.39 (t, 1H, J=7.4Hz), 7.50 (d, 1H, J= 8.6Hz), 7.76 (dd, 1H, J=8.6, 1.8Hz), 8.12 (d, 1H, J=7.9Hz), 8.19 (d, 1H, J=8.6Hz), 8.22 (d, 1H, J=1.8Hz), 11.35 (s, 1H) MS: m/z 318 (M <sup>+</sup> )

【表4】

【0121】

表1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
37	1-ベンゼンスルホニル-5-ベンジロキシ-1H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.06(s, 2H), 6.58(d, 1H), 7.0-7.1(m, 2H), 7.2-7.8(m, 9H), 7.8-7.9(m, 3H) MS:m/z 369(M <sup>+</sup> )
38	1-ベンゼンスルホニル-5-ベンジロキシ-2-(α-ヒドロキシベンジル)-1H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.02(s, 2H), 6.09(s, 1H), 6.94(s, 1H), 6.88(d, 1H), 6.99(dd, 1H), 7.2-7.6(m, 13H), 7.72(d, 2H), 7.99(d, 1H) MS:m/z 469(M <sup>+</sup> )
39	2-ベンゾイル-5-ベンジロキシ-1H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.11(s, 2H), 7.07(s, 1H), 7.1-7.2(m, 2H), 7.33(m, 1H), 7.4-7.7(m, 9H), 7.98(m, 1H), 9.17(br, 1H) MS:m/z 327(M <sup>+</sup> )
40	2-ベンジル-5-ヒドロキシ-1H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 4.10(s, 2H), 4.46(br, 1H), 6.20(s, 1H), 6.58(m, 1H), 6.95(d, 1H), 7.09(d, 1H), 7.2-7.4(m, 5H), 7.65(br, 1H) MS:m/z 223(M <sup>+</sup> )
41	プロモメチル 4-イソプロピルフェニルケトン	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.28(d, 6H, J=8.8Hz), 2.93-3.04(m, 1H), 4.44(s, 2H), 7.35(d, 2H, J=8.3Hz), 7.94-7.92(m, 2H) MS:m/z 223(M <sup>+</sup> )
42	2-(4-イソプロピルフェニル)-5-メトキシ-1H-インドール	融点 166-169°C NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.28(d, 6H, J=8.8Hz), 2.89-3.00(m, 1H), 3.86(s, 3H), 6.71(d, 1H, J=2.0Hz), 6.84(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.08(d, 1H, J=2.4Hz), 7.26-7.31(m, 3H), 7.57(d, 2H, J=8.3Hz), 8.19(br, 1H) MS:m/z 265(M <sup>+</sup> )
43	5-ベンジロキシ-1-tert-ブトキシカルボニル-1H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.65(s, 9H), 5.10(s, 2H), 6.48(d, 1H, J=3.9Hz), 7.00, 6.99-7.02(m, 1H), 7.09(d, 1H, J=2.4Hz), 7.31(t, 1H, J=7.3Hz), 7.36-7.40(m, 2H), 7.45(d, 2H, J=7.3Hz), 7.56(d, 1H, J=3.4Hz), 8.03(br, m) MS:m/z 323(M <sup>+</sup> )

【0122】

【表5】

表1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
44	4-[ (2-ベンジ ル-1-メチル-1 H-インドール-5 -イル) オキシ]- 3-クロベンゾニ トリル	融点 99-101℃ NMR(CDCI <sub>3</sub> ) δ: 3.61(s, 3H), 4.15(s, 2H), 6.26(s, 1H), 6.75(d, 1H, J=8.8Hz), 6.90(dd, 1H, J=8.8, 2.4 Hz), 7.2-7.4(m, 8H), 7.78(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 372(M <sup>+</sup> )
45	3-クロロ-4- [ (2-(4-イソ プロピルフェニル) -1-メチル-1H -インドール-5- イル) オキシ] ベン ゾニトリル	NMR(CDCI <sub>3</sub> ) δ: 1.32(d, 6H, J=6.8Hz), 2.99(septet, 1H, J=6.8Hz), 3.78(s, 3H), 6.53(s, 1H), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.97(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.32 -7.46(m, 7H), 7.74(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 400(M <sup>+</sup> )
46	5-ベンジルオキシ -1-(4-イソプロ ピルベンジル)- 1H-インドール	融点 73-75℃ NMR(CDCI <sub>3</sub> ) δ: 1.21(d, 6H, J=6.7Hz), 2.81-2.90(m, 1H), 5.09(s, 2H), 5.24(s, 2H), 6.44(d, 1H, J=2.4 Hz), 6.91(dd, 1H, J=9.1, 2.5Hz), 7.03(d, 2H, J= 8.6Hz), 7.09(d, 1H, J=3.1Hz), 7.14(d, 2H, J= 7.9Hz), 7.17-7.19(m, 2H), 7.30(t, 1H, J=7.3 Hz), 7.35-7.39(m, 2H), 7.46(d, 1H, J=7.3Hz) MS:m/z 355(M <sup>+</sup> )
47	5-ベンジルオキシ -1-(4-ビフェ ニルメチル)- 1H-インドール	融点 148-151℃ NMR(CDCI <sub>3</sub> ) δ: 5.10(s, 2H), 5.33(s, 2H), 6.48(d, 1H, J= 2.4Hz), 6.47-6.94(m, 1H), 7.13-7.21(m, 5H), 7.29-7.55(m, 12H) MS:m/z 389(M <sup>+</sup> )
48	5-ベンジルオキシ -1-(4-イソプロ ピルベンジル)- 1H-インドール	NMR(CDCI <sub>3</sub> ) δ: 0.85(d, 6H, J=6.4Hz), 1.78-1.84(m, 1H), 2.42(d, 2H, J=6.8Hz), 5.08(s, 2H), 5.22(s, 2H), 6.44(d, 1H, J=3.4Hz), 6.89-6.92(m, 1H), 6.99-7.08(m, 5H), 7.15-7.18(m, 2H), 7.29(t, 1H, J=7.3Hz), 7.37(t, 2H, J=7.3Hz), 7.45(d, 2H, J=7.3Hz) MS:m/z 369(M <sup>+</sup> )

【表6】

【0123】

表1 (つづき)

参考例 番号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
49	5-ベンジルオキシ-1-(4-tert-ブチルベンジル)-1H-インドール	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.29(s, 9H), 5.09(s, 2H), 5.24(s, 2H), 6.44(d, 1H, J=2.9Hz), 6.90-6.93(m, 1H), 7.03(d, 2H, J=8.3Hz), 7.09(d, 1H, J=9.4Hz), 7.18-7.20(m, 2H), 7.29-7.32(m, 3H), 7.36-7.39(m, 2H), 7.49(d, 2H, J=6.8Hz) MS: m/z 369(M <sup>+</sup> )
50	5-ベンジルオキシ-1-シクロヘキシメチル-1H-インドール	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 0.92-1.01(m, 2H), 1.12-1.25(m, 3H), 1.59-1.70(m, 5H), 1.77-1.86(m, 1H), 3.88(d, 2H, J=7.3Hz), 5.09(s, 2H), 6.37(d, 1H, J=2.9Hz), 6.93-6.96(m, 1H), 7.02(d, 1H, J=2.9Hz), 7.16(d, 1H, J=2.0Hz), 7.22(d, 1H, J=8.8Hz), 7.29-7.32(m, 1H), 7.35-7.39(m, 2H), 7.47(d, 2H, J=7.3Hz) MS: m/z 319(M <sup>+</sup> )
51	5-ベンジルオキシ-1-(2-シクロヘキシルエチル)-1H-インドール	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 0.83-1.04(m, 2H), 1.08-1.35(m, 4H), 1.58-1.82(m, 7H), 4.06-4.12(m, 2H), 5.10(s, 2H), 6.38(d, 1H, J=2.5Hz), 6.94(dd, 1H, J=8.8, 2.5Hz), 7.05(d, 1H, J=2.9Hz), 7.16(d, 1H, J=2.5Hz), 7.22(d, 1H, J=8.8Hz), 7.31(t, 1H, J=7.3Hz), 7.35-7.42(m, 2H), 7.47(d, 2H, J=7.3Hz) MS: m/z 333(M <sup>+</sup> )
52	5-ベンジルオキシ-1-フェネチル-1H-インドール	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 3.08(t, 2H, J=7.3Hz), 4.30(t, 2H, J=7.3Hz), 5.11(s, 2H), 6.34(d, 1H, J=3.1Hz), 6.89(d, 1H, J=3.1Hz), 6.95(dd, 1H, J=9.1, 2.5Hz), 7.07-7.09(m, 2H), 7.17(d, 1H, J=2.5Hz), 7.20-7.33(m, 4H), 7.31(t, 1H, J=7.3Hz), 7.36-7.40(m, 2H), 7.48(d, 2H, J=7.3Hz) MS: m/z 327(M <sup>+</sup> )
53	5-ベンジルオキシ-1-(3-フェニルプロピル)-1H-インドール	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 2.17(quintet, 2H, J=7.3Hz), 2.60-2.64(m, 2H), 4.07-4.10(m, 2H), 5.10(s, 2H), 6.40(d, 1H, J=2.4Hz), 6.88-6.98(m, 1H), 7.06(d, 1H, J=3.1Hz), 7.10-7.34(m, 8H), 7.38(t, 2H, J=7.3Hz), 7.47(d, 2H, J=7.3Hz) MS: m/z 341(M <sup>+</sup> )

【0124】

【表7】

表1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
54	5-ベンジルオキシ -1-(4-フェニ ルブチル)-1H- インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.57-1.70(m, 2H), 1.80-1.91(m, 2H), 2.56-2.65(m, 2H), 4.08(t, 2H, J=6.8Hz), 5.10 (s, 2H), 6.38(d, 1H, J=3.4Hz), 6.94(dd, 1H, J= 8.8, 2.4Hz), 7.08(d, 1H, J=3.4Hz), 7.11-7.42 (m, 10H), 7.47(d, 2H, J=6.8Hz) MS:m/z 355(M <sup>+</sup> )
55	5-ベンジルオキシ -1-(3-メチル -3-フェニルブチ ル)-1H-インド ール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.40(s, 6H), 2.08-2.17(m, 2H), 3.77- 3.85(m, 2H), 5.08(s, 2H), 6.34(d, 1H, J=2.4 Hz), 6.89-6.94(m, 1H), 6.97(d, 1H, J=8.8Hz), 7.13(d, 1H, J=2.0Hz), 7.22-7.43(m, 9H), 7.46 (d, 2H, J=6.8Hz) MS:m/z 369(M <sup>+</sup> )
56	5-ベンジルオキシ -1-(3-フェノ キシプロピル)- 1H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.20-2.29(m, 2H), 3.85(t, 2H, J=5.9Hz), 4.28-4.86(m, 2H), 5.09(s, 2H), 6.37(d, 1H, J= 2.9Hz), 6.83-6.98(m, 4H), 7.04(d, 1H, J=2.9 Hz), 7.16(d, 1H, J=2.4Hz), 7.22-7.42(m, 6H), 7.46(d, 2H, J=7.3Hz) MS:m/z 357(M <sup>+</sup> )
57	3-クロロ-4- [1-(2-クロ ロベンジル)-1H- インドール-5- イル]オキシ]ベン ゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.44(s, 2H), 6.57(d, 1H, J=2.9Hz), 6.68 (d, 1H, J=7.8Hz), 6.79(d, 1H, J=8.3Hz), 6.88- 6.95(m, 1H), 7.11-7.18(m, 1H), 7.21-7.47(m, 6H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 357(M <sup>+</sup> )
58	3-クロロ-4- [1-(3-クロ ロベンジル)-1H- インドール-5- イル]オキシ]ベン ゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.31(s, 2H), 6.56(d, 1H, J=3.4Hz), 6.79 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.91(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 6.97-7.03(m, 4H), 7.12(s, 1H), 7.19-7.30(m, 4H), 7.33-7.41(m, 2H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 357(M <sup>+</sup> )
59	3-クロロ-4- [1-(4-クロ ロベンジル)-1H- インドール-5- イル]オキシ]ベン ゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.31(s, 2H), 6.53-6.57(m, 1H), 6.77(d, 1H, J=8.8Hz), 6.90(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.06 (d, 2H, J=8.3Hz), 7.18-7.41(m, 6H), 7.73(d, 1H, 2.0Hz) MS:m/z 392(M <sup>+</sup> )

【0125】

【表8】

表 1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
60	3-クロロ-4-[1-(2-メチルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシベンゾニトリル	融点 120-124°C NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 2.32(s, 3H), 5.30(s, 2H), 6.53(d, 1H, J=2.9Hz), 6.76-6.82(m, 2H), 6.91(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.07-7.17(m, 2H), 7.21-7.41(m, 5H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 372(M <sup>+</sup> )
61	3-クロロ-4-[1-(3-メチルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシベンゾニトリル	NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 2.32(s, 3H), 5.30(s, 2H), 6.53(d, 1H, J=2.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.87-7.00(m, 3H), 7.10(d, 1H, J=7.9Hz), 7.17-7.40(m, 5H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 372(M <sup>+</sup> )
62	3-クロロ-4-[1-(4-メチルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシベンゾニトリル	融点 144-145°C NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 2.33(s, 3H), 5.29(s, 2H), 6.52(d, 1H, J=2.9Hz), 6.77(d, 1H, J=8.3Hz), 6.89(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.04(d, 2H, J=8.3Hz), 7.13(d, 2H, J=7.8Hz), 7.20(d, 1H, J=3.4Hz), 7.27-7.39(m, 3H), 7.72(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 372(M <sup>+</sup> )
63	3-クロロ-4-[1-(5-フェニルペンチル)-1H-インドール-5-イル]オキシベンゾニトリル	NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.32-1.43(m, 2H), 1.61-1.72(m, 2H), 1.82-1.93(m, 2H), 2.56-2.63(m, 2H), 3.43-3.52(m, 2H), 4.08-4.15(m, 2H), 6.46(d, 1H, J=2.9Hz), 6.77(d, 1H, J=8.8Hz), 6.92(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.11-7.38(m, 9H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 414(M <sup>+</sup> )
64	3-クロロ-4-[1-(6-フェニルヘキシル)-1H-インドール-5-イル]オキシベンゾニトリル	NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.29-1.43(m, 4H), 1.54-1.66(m, 2H), 1.79-1.90(m, 2H), 2.54-2.62(m, 2H), 4.08-4.15(m, 2H), 6.46(d, 1H, J=2.9Hz), 6.77(d, 1H, J=8.8Hz), 6.92(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.12-7.38(m, 9H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 428(M <sup>+</sup> )

【表9】

【0126】



表1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
65	3-クロロ-4-[1-(3-シクロヘキシルプロピル)-1H-インドール-5-イル]オキシベンゾニトリル	NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 0.79-0.95(m, 2H), 1.05-1.30(m, 6H), 1.59-1.74(m, 5H), 1.81-1.92(m, 2H), 4.07-4.15(m, 2H), 6.47(d, 1H, J=2.9Hz), 6.77(d, 1H, J=8.8Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.17(d, 1H, J=2.9Hz), 7.30-7.40(m, 3H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 392(M <sup>+</sup> )
66	3-クロロ-4-[1-(4-シクロヘキシルブチル)-1H-インドール-5-イル]オキシベンゾニトリル	NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 0.77-0.92(m, 2H), 1.05-1.39(m, 8H), 1.58-1.73(m, 5H), 1.78-1.88(m, 2H), 4.08-4.17(m, 2H), 6.47(d, 1H, J=2.9Hz), 6.77(d, 1H, J=8.8Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.17(d, 1H, J=3.4Hz), 7.29-7.40(m, 8H), 7.73(d, 1H, J=2.4Hz) MS: m/z 406(M <sup>+</sup> )
67	3-クロロ-4-[1-(1-シクロヘプチルメチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]ベンゾニトリル	NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 0.7-2.4(m, 13H), 3.93(d, 2H, J=7.3Hz), 6.45(d, 1H, J=2.9Hz), 6.72-7.05(m, 2H), 7.14(d, 1H, J=3.2Hz), 7.22-7.52(m, 8H), 7.71(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 378(M <sup>+</sup> )
68	3-クロロ-4-[1-(1-ナフチルメチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]ベンゾニトリル	融点 154-158°C NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 5.80(s, 2H), 5.54(d, 1H, J=3.4Hz), 6.82(d, 1H, J=8.8Hz), 6.90-6.98(m, 2H), 7.14(d, 1H, J=2.9Hz), 7.33-7.42(m, 4H), 7.51-7.60(m, 2H), 7.74(d, 1H, J=2.0Hz), 7.84(d, 1H, J=8.3Hz), 7.89-8.00(m, 2H) MS: m/z 408(M <sup>+</sup> )
69	4-[1-(1-(3-ビフェニリルメチル)-1H-インドール-5-イル)オキシ]-3-クロロベンゾニトリル	NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 5.41(s, 2H), 6.55(d, 1H, J=2.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.91(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.10(d, 1H, J=7.8Hz), 7.22-7.57(m, 9H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 434(M <sup>+</sup> )
70	3-クロロ-4-[1-(4-フルオロベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]-3-クロロベンゾニトリル	NMR(CDCI <sub>3</sub> ) $\delta$ : 5.31(s, 2H), 6.54(d, 1H, J=2.9Hz), 6.77(d, 1H, J=8.3Hz), 6.86-6.94(m, 1H), 7.01(t, 2H, J=8.8Hz), 7.06-7.15(m, 2H), 7.20(d, 1H, J=3.4Hz), 7.27(d, 1H, J=9.3Hz), 7.31-7.40(m, 2H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 376(M <sup>+</sup> )

【0127】

【表10】

表1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
71	4-[ [1-(4- プロモベンジル)- 1H-インドール- 5-イル] オキシ] -3-クロロベンゾ ニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.29(s, 2H), 6.51-6.57(m, 1H), 6.77(d, 1H, J=8.3Hz), 6.90(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 6.99 (d, 2H, J=8.3Hz), 7.17-7.28(m, 2H), 7.31-7.41 (m, 2H), 7.44(d, 2H, J=8.3Hz), 7.73(d, 1H, J= 2.0Hz) MS: m/z 437(M <sup>+</sup> )
72	3-クロロ-4- [ [1-(4-メト キシベンジル)-1 H-インドール-5 -イル] オキシ] ベ ンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 3.79(s, 3H), 5.27(s, 2H), 6.51(d, 1H, J= 3.4Hz), 6.77(d, 1H, J=8.8Hz), 6.82-6.92(m, 3H), 7.09(d, 2H, J=8.8Hz), 7.19(d, 1H, J=3.4 Hz), 7.28-7.39(m, 3H), 7.72(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 388(M <sup>+</sup> )
73	3-クロロ-4- [ [1-(4-シク ロヘキシルベンジ ル)-1H-インド ール-5-イル] オキ シ] ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.18-1.45(m, 5H), 1.69-1.91(m, 5H), 2.41-2.52(m, 1H), 5.30(s, 2H), 6.52(d, 1H, J= 2.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.90(dd, 1H, J= 8.8, 2.0Hz), 7.06(d, 2H, J=7.8Hz), 7.16(d, 2H, J=7.8Hz), 7.21(d, 1H, J=3.4Hz), 7.29-7.40(m, 3H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 440(M <sup>+</sup> )
74	4-[ [1-[4- (1-アダマンテル )ベンジル]-1H- インドール-5- イル] オキシ]-3- クロロベンゾニ トリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.69-1.94(m, 12H), 2.04-2.13(m, 3H), 5.31(s, 2H), 6.53(d, 1H, J=2.8Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.90(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.09(d, 2H, J=8.3Hz), 7.21(d, 1H, J=2.9Hz), 7.28-7.42 (m, 5H), 7.73(d, 1H, J=2.4Hz) MS: m/z 492(M <sup>+</sup> )
75	4-[ [1-(2- ビフェニルメチル ) -1H-インド ール-5-イル] オキ シ]-3-クロロベ ンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.26(s, 2H), 6.46(d, 1H, J=3.4Hz), 6.74 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.81(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 6.96(d, 1H, J=7.3Hz), 7.00-7.07(m, 2H), 7.23- 7.47(m, 10H), 7.72(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 434(M <sup>+</sup> )
76	3-クロロ-4- [ (1-イソアミル -1H-インドール -5-イル) オキシ ] ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.98(d, 6H, J=6.8Hz), 1.57-1.69(m, 1H), 1.72-1.81(m, 2H), 4.12-4.19(m, 2H), 6.45- 6.49(m, 1H), 6.78(d, 1H, J=8.3Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.18(d, 1H, J=2.9Hz), 7.28- 7.41(m, 3H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 338(M <sup>+</sup> )

【0128】

【表11】

表1 (つづき)

参考例 番号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
77	3-クロロ-4-[1-(4-ピリジルメチル)-1H-インドール-5-イル]オキシベンゾニトリル	融点 174-181°C NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 5.38(s, 2H), 6.80(d, 1H, J=2.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.88-7.02(m, 3H), 7.17-7.25(m, 2H), 7.34-7.42(m, 2H), 7.74(d, 1H, J=2.0Hz), 8.56(d, 2H, J=4.9Hz) MS:m/z 359(M <sup>+</sup> )
78	1-(4-ピフェニルメチル)-5-メトキシ-2-メチル-1H-インドール	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 2.37(d, 3H, J=1.0Hz), 3.84(s, 3H), 5.29(s, 2H), 6.27(s, 1H), 6.75-6.79(m, 1H), 7.01-7.14(m, 4H), 7.23-7.56(m, 7H) MS:m/z 327(M <sup>+</sup> )
79	3-クロロ-4-[1-(1-シクロペンチルメチル)-1H-インドール-5-イル]オキシベンズアミド	融点 174-176°C NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.22-1.36(m, 2H), 1.51-1.79(m, 5H), 2.38-2.51(m, 1H), 4.04(d, 2H, J=7.3Hz), 5.45-6.15(br, 2H), 6.45(d, 1H, J=3.9Hz), 6.80(d, 1H, J=8.8Hz), 6.95(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.17(d, 1H, J=2.6Hz), 7.31(d, 1H, J=2.4Hz), 7.36(d, 1H, J=8.8Hz), 7.55(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.93(d, 1H, J=2.4Hz) MS:m/z 388(M <sup>+</sup> )
80	1-エトキシカルボニル-5-ヒドロキシインドリン	融点 128-129°C NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.24-1.33(br, 3H), 3.04(t, 2H, J=8.8Hz), 3.99(br, 2H), 4.25(br, 2H), 6.04(br, 1H), 6.86(d, 1H, J=8.8Hz), 6.70(s, 1H), 7.32, 7.69(br, br, 合わせて1H) MS:m/z 207(M <sup>+</sup> )
81	1-tert-ブトキシカルボニル-5-ヒドロキシインドリン	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.54(br, 9H), 3.00-3.04(m, 2H), 3.85(m, 2H), 5.77(br, 1H), 6.62-6.65(m, 1H), 6.68(s, 1H), 7.28, 7.67(br, br, 合わせて1H) MS:m/z 235(M <sup>+</sup> )
82	5-ヒドロキシ-1-(4-イソブチルベンジル)-1H-インドール	融点 86-87°C NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) $\delta$ : 0.87(d, 6H, J=6.4Hz), 1.76-1.86(m, 1H), 2.42(d, 2H, J=7.3Hz), 4.61(br, 1H), 5.23(s, 2H), 6.40(d, 1H, J=2.9Hz), 6.72-6.74(m, 1H), 6.99-7.13(m, 7H) MS:m/z 279(M <sup>+</sup> )

【0129】

【表12】

表 1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
83	1-(4-tert-ブチルベンジル)-5-ヒドロキシ-1H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.27(s, 9H), 4.60(br. 1H), 5.23(s, 2H), 6.40(d, 1H, J=2.9Hz), 6.72-6.75(m, 1H), 7.02-7.04(m, 3H), 7.09(d, 1H, J=2.9Hz), 7.13(d, 1H, J=8.3Hz), 7.29-7.31(m, 2H) MS:m/z 279(M <sup>+</sup> )
84	5-ヒドロキシ-1-(4-イソプロピルベンジル)-1H-インドール	融点 119-121°C NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.21(d, 6H, J=6.8Hz), 2.86(septet, 1H, J=6.8Hz), 4.48(s, 1H), 5.24(s, 2H), 6.41(d, 1H, J=2.9Hz), 6.74(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.01-7.07(m, 3H), 7.10(d, 1H, J=3.4Hz), 7.12-7.18(m, 3H) MS:m/z 265(M <sup>+</sup> )
85	1-(4-ピフェニルメチル)-5-ヒドロキシ-1H-インドール	融点 170-178°C NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 4.48(s, 1H), 5.32(s, 2H), 6.42-6.46(m, 1H), 6.75(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.06(d, 1H, J=2.4Hz), 7.12-7.19(m, 4H), 7.30-7.37(m, 1H), 7.38-7.45(m, 2H), 7.48-7.58(m, 4H) MS:m/z 299(M <sup>+</sup> )
86	5-ヒドロキシ-1-フェネチル-1H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 3.08(t, 2H, J=7.3Hz), 4.29(t, 2H, J=7.3Hz), 4.54(s, 1H), 6.23-6.32(m, 1H), 6.78(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 6.89(d, 1H, J=2.9Hz), 7.02(d, 1H, J=2.4Hz), 7.05-7.11(m, 2H), 7.15-7.31(m, 4H) MS:m/z 237(M <sup>+</sup> )
87	5-ヒドロキシ-1-(3-フェニルプロピル)-1H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 2.17(quinlet, 2H, J=7.3Hz), 2.58-2.65(m, 2H), 4.05-4.12(m, 2H), 4.53(s, 1H), 6.35-6.38(m, 1H), 6.77(dd, 1H, J=8.9, 2.5Hz), 7.03(d, 1H, J=2.5Hz), 7.06(d, 1H, J=2.9Hz), 7.11-7.32(m, 6H) MS:m/z 251(M <sup>+</sup> )
88	5-ヒドロキシ-1-(4-フェニルブチル)-1H-インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.58-1.69(m, 2H), 1.81-1.91(m, 2H), 2.58-2.64(m, 2H), 4.03-4.11(m, 2H), 4.53(s, 1H), 6.34(d, 1H, J=2.5Hz), 6.77(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.00-7.06(m, 2H), 7.10-7.21(m, 4H), 7.23-7.29(m, 2H) MS:m/z 265(M <sup>+</sup> )

【0130】

【表 13】

表 1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
89	1-シクロヘキシル メチル-5-ヒドロ キシ-1H-インド ール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.92-1.00(m, 2H), 1.08-1.22(m, 3H), 1.58-1.70(m, 5H), 1.76-1.87(m, 1H), 3.86(d, 2H, J=6.8Hz), 4.53(br, 1H), 6.33(d, 1H, J=2.9 Hz), 6.76-6.79(m, 1H), 7.01(d, 2H, J=2.9Hz), 7.17(d, 1H, J=8.8Hz) MS:m/z 229(M <sup>+</sup> )
90	5-ヒドロキシ-1 -(2-シクロヘキ シルエチル)-1H -インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.89-1.03(m, 2H), 1.08-1.34(m, 4H), 1.57-1.79(m, 7H), 4.03-4.12(m, 2H), 4.66(br, 1H), 6.34(d, 1H, J=2.4Hz), 6.78(dd, 1H, J=8.8, 2.5Hz), 7.02(d, 1H, J=2.4Hz), 7.05(d, 1H, J= 2.9Hz), 7.18(d, 1H, J=8.8Hz) MS:m/z 243(M <sup>+</sup> )
91	5-ヒドロキシ-1 -(3-メチル-8 -フェニルブチル) -1H-インドール	融点 94-100°C NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.40(s, 6H), 2.09-2.17(m, 2H), 3.76- 3.83(m, 2H), 4.43(s, 1H), 6.30(d, 1H, J=2.9 Hz), 6.72(dd, 1H, J=8.3, 2.4Hz), 6.89-6.94(m, 2H), 6.99(d, 1H, J=2.4Hz), 7.22-7.29(m, 1H), 7.35-7.44(m, 4H) MS:m/z 279(M <sup>+</sup> )
92	5-ヒドロキシ-1 -(3-フェノキシ プロピル)-1H- インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.19-2.30(m, 2H), 3.82-3.90(m, 2H), 4.28-4.35(m, 2H), 4.75(s, 1H), 6.33(d, 1H, J= 2.9Hz), 6.74(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 6.87(d, 2H, J=7.8Hz), 6.95(t, 1H, J=7.3Hz), 7.01(d, 1H, J=2.4Hz), 7.04(d, 1H, J=3.4Hz), 7.20(d, 1H, J=8.8Hz), 7.23-7.33(m, 2H) MS:m/z 267(M <sup>+</sup> )
93	1-(4-ビフェニ リルメチル)-5- ヒドロキシ-2-メ チル-1H-インド ール	融点 152-154°C NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.35(s, 3H), 4.58(s, 1H), 5.29(s, 2H), 6.22(s, 1H), 6.65-6.88(m, 1H), 6.98-7.07(m, 4H), 7.30-7.34(m, 1H), 7.39-7.42(m, 2H), 7.47 -7.54(m, 4H) MS:m/z 313(M <sup>+</sup> )

【0131】

【表 14】

表1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
94	2-ベンゾイル-5- -ヒドロキシ-1H- -インドール	融点 172-174°C NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 8.8-7.1(m, 3H), 7.36(d, 1H, J=8.8Hz), 7.53(dd, 2H, J=7.8, 7.3Hz), 7.26(m, 1H), 7.97 (m, 1H), 9.18(br, 1H) MS:m/z 237(M <sup>+</sup> )
95	5-ヒドロキシ-2- -(4-イソプロピ ルフェニル)-1H- -インドール	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.28(d, 6H, J=6.8Hz), 2.88-3.01(m, 1H), 4.51(s, 1H), 5.57(d, 1H, J=2.0Hz), 6.72-6.78 (m, 1H), 7.02(d, 1H, J=2.0Hz), 7.21-7.33(m, 3H), 7.57(d, 2H, J=7.8Hz), 8.18(br, 1H) MS:m/z 251(M <sup>+</sup> )
96	1-ベンジル-6- -ヒドロキシ-1, 2, 3, 4-テトラヒ ドロキノリン	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.97-2.00(m, 2H), 2.77(br, 2H), 3.28 (br, 2H), 4.41(br, 2H), 6.44-6.62(m, 3H), 7.18 -7.35(m, 5H) MS:m/z 239(M <sup>+</sup> )
97	4-[ (2-ベンジ ル-1H-インドー ル-5-イル) オキシ ] -3-クロロベン ゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 4.13(s, 2H), 6.32(s, 1H), 6.76(d, 1H), 6.83(dd, 1H), 7.2-7.4(m, 7H), 7.72(d, 1H), 7.91(br, 1H) MS:m/z 358(M <sup>+</sup> )
98	4-[ (2-ベンゾ イル-1H-インド ール-5-イル) オ キシ ]-3-クロロ ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 6.81(d, 1H, J=8.3Hz), 7.1-7.2(m, 2H), 7.4-7.5(m, 2H), 7.5-7.6(m, 3H), 7.55(t, 1H, J= 7.3Hz), 7.76(d, 1H, J=1.9Hz), 8.00(m, 1H), 9.37(br, 1H) MS:m/z 372(M <sup>+</sup> )
99	3-クロロ-4- [ [2-(4-イソ プロピルフェニル) -1H-インドール -5-イル] オキシ ] ベンゾニトリル	融点 177-180°C NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.30(d, 6H, J=6.8Hz), 2.96(septet, 1H, J= 6.8Hz), 6.77(d, 1H, J=2.0Hz), 6.81(d, 1H, J= 8.3Hz), 6.91(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.29-7.47 (m, 5H), 7.58-7.65(m, 2H), 7.74(d, 1H, J=2.0 Hz), 8.43(br, 1H) MS:m/z 386(M <sup>+</sup> )

【0132】

【表15】

表1 (つづき)

参考例 番号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
100	3-クロロ-4-[ (1H-インドール-5-イル) オキシ] ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 6.55 (t, 1H, J=1.0Hz), 6.76 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.91-6.94 (m, 1H), 7.29 (t, 1H, J=2.9Hz), 7.33-7.37 (m, 2H), 7.42 (d, 1H, J=8.8Hz), 7.72 (d, 1H, J=2.0Hz), 8.37 (br, 1H) MS:m/z 288 (M <sup>+</sup> )
101	3-クロロ-4-[ (1-メチル-1H-インドール-5-イル) オキシ] ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 3.84 (s, 3H), 6.48 (d, 1H, J=2.4Hz), 6.75 (d, 1H, J=8.3Hz), 6.96 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.14 (d, 1H, J=2.9Hz), 7.3-7.4 (m, 3H), 7.73 (d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 282 (M <sup>+</sup> )
102	3-クロロ-4-[ [1-(4-イソプロピルベンジル)-1H-インドール-5-イル] オキシ] ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 0.88 (d, 6H, J=6.4Hz), 1.80-1.85 (m, 1H), 2.44 (d, 2H, J=7.3Hz), 5.30 (s, 2H), 6.52 (d, 1H, J=3.4Hz), 6.77 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.87-6.90 (m, 1H), 7.04-7.10 (m, 4H), 7.20 (d, 1H, J=2.9Hz), 7.30-7.37 (m, 3H), 7.71 (d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 414 (M <sup>+</sup> )
103	3-クロロ-4-[ [1-(4-イソプロピルベンジル)-1H-インドール-5-イル] オキシ] ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.23 (d, 6H, J=6.8Hz), 2.83-2.95 (m, 1H), 5.30 (s, 2H), 5.52 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.78 (d, 1H, J=8.3Hz), 6.87-6.92 (m, 1H), 7.07 (d, 2H, J=8.3Hz), 7.16-7.23 (m, 3H), 7.29-7.39 (m, 3H), 7.72 (d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 400 (M <sup>+</sup> )
104	4-[ [1-(4-tert-ブチルベンジル)-1H-インドール-5-イル] オキシ] -3-クロロベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.30 (s, 9H), 5.30 (s, 2H), 6.52 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.77 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.88-6.91 (m, 1H), 7.07 (d, 2H, J=8.8Hz), 7.20 (d, 1H, J=2.9Hz), 7.32-7.38 (m, 5H), 7.72 (d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 414 (M <sup>+</sup> )
105	4-[ [1-(4-ビフェニルメチル)-1H-インドール-5-イル] オキシ] -3-クロロベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 5.39 (s, 2H), 6.56 (d, 1H, J=3.9Hz), 6.78 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.91 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.18-7.28 (m, 3H), 7.30-7.47 (m, 5H), 7.49-7.61 (m, 4H), 7.73 (d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 434 (M <sup>+</sup> )

【0133】

【表16】

表1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
106	3-クロロ-4- [ (1-フェネチル -1H-インドール -5-イル) オキシ ] ベンゾニトリル	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 3.12(t, 2H, J=7.3Hz), 4.37(t, 2H, J=7.3 Hz), 6.43(d, 1H, J=2.9Hz), 6.76(d, 1H, J=8.8 Hz), 6.91(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.01(d, 1H, J= 2.9Hz), 7.04-7.11(m, 2H), 7.20-7.34(m, 5H), 7.38(dd, 1H, J=8.3, 2.0Hz), 7.73(d, 1H, J=2.0 Hz) MS:m/z 372(M <sup>+</sup> )
107	3-クロロ-4- [ [1-(3-フェ ニルプロピル)-1 H-インドール-5 -イル] オキシ] ベ ンゾニトリル	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 2.17-2.27(m, 2H), 2.62-2.70(m, 2H), 4.12-4.19(m, 2H), 6.49(d, 1H, J=3.4Hz), 6.77 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.92(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.14-7.41(m, 9H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 386(M <sup>+</sup> )
108	3-クロロ-4- [ [1-(4-フェ ニルブチル)-1H -インドール-5- イル] オキシ] ベン ゾニトリル	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 1.63-1.72(m, 2H), 1.85-1.95(m, 2H), 2.61-2.68(m, 2H), 4.11-4.18(m, 2H), 6.47(d, 1H, J=2.9Hz), 6.77(d, 1H, J=8.8Hz), 6.92(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.12-7.22(m, 4H), 7.24- 7.41(m, 5H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 400(M <sup>+</sup> )
109	3-クロロ-4- [ [ (1-シクロヘ キシルメチル)-1 H-インドール-5 -イル] オキシ] ベ ンゾニトリル	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 0.96-1.05(m, 2H), 1.15-1.27(m, 3H), 1.62-1.74(m, 5H), 1.81-1.90(m, 1H), 3.94(d, 2H, J=6.8Hz), 6.46(d, 1H, J=2.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.90-6.93(m, 1H), 7.13(d, 1H, J= 2.9Hz), 7.31-7.38(m, 3H), 7.72-7.74(m, 1H) MS:m/z 364(M <sup>+</sup> )
110	3-クロロ-4- [ [1-(2-シク ロヘキシルエチル) -1H-インドール -5-イル] オキシ ] ベンゾニトリル	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 0.92-1.07(m, 2H), 1.11-1.38(m, 4H), 1.62-1.83(m, 7H), 4.15(t, 2H, J=7.8Hz), 6.47 (d, 1H, J=3.4Hz), 6.77(d, 1H, J=8.8Hz), 6.92 (dd, 1H, J=8.8, 2.5Hz), 7.17(d, 1H, J=2.9Hz), 7.29-7.40(m, 3H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 378(M <sup>+</sup> )

【0134】

【表17】



表1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
111	3-クロロ-4-[ [1-(3-メチ ル-3-フェニル チル)-1H-イン ドール-5-イル] オキシ]ベンゾニ トリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.43(s, 6H), 2.13-2.22(m, 2H), 3.83- 3.91(m, 2H), 5.42(d, 1H, J=3.2Hz), 6.74(d, 1H, J=8.8Hz), 6.87(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.02- 7.09(m, 2H), 7.24-7.30(m, 2H), 7.33-7.46(m, 5H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 414(M <sup>+</sup> )
112	3-クロロ-4-[ [1-(3-フェ ノキシプロピル)- 1H-インドール- 5-イル]オキシ] ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.24-2.35(m, 2H), 3.84-3.93(m, 2H), 4.41(t, 2H, J=6.8Hz), 6.47(d, 1H, J=3.4Hz), 6.73(d, 1H, J=8.3Hz), 6.84-7.00(m, 4H), 7.17 (d, 1H, J=3.4Hz), 7.23-7.42(m, 5H), 7.73(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 402(M <sup>+</sup> )
113	4-[ [1-(4- ビフェニルメチル ) -2-メチル-1 H-インドール-5- イル] オキシ] - 3-クロロベンゾ ニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.41(s, 3H), 5.36(s, 2H), 6.35(s, 1H), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.83(dd, 1H, J=8.8, 2.4 Hz), 7.05(d, 2H, J=8.3Hz), 7.23-7.26(m, 2H), 7.32-7.44(m, 4H), 7.51-7.55(m, 4H), 7.72(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 448(M <sup>+</sup> )
114	3-クロロ-4-[ [1-(1-エトキンカ ルボニル-5-イン ドリニル) オキシ] ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.36(br, 3H), 3.14(t, 2H, J=8.8Hz), 4.6- 4.10(m, 2H), 4.29(br, 2H), 6.81(d, 1H, J=8.3 Hz), 6.88-6.89(m, 2H), 7.42-7.44(m, 1H), 7.73 (d, 1H, J=2.0Hz), 7.90(br, 1H) MS:m/z 342(M <sup>+</sup> )
115	4-[ (1-ter t-ブトキシカルボ ニル)-5-インドニ ル] オキシ] -3- クロロベンゾニ トリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.58(d, 9H, J=9.3Hz), 3.08-3.13(m, 2H), 4.03(t, 2H, J=8.3Hz), 6.80(d, 1H, J=8.8Hz), 6.88(s, 2H), 7.42(dd, 1H, J=8.3, 2.0Hz), 7.73 (d, 1H, J=2.0Hz), 7.89(br, 1H) MS:m/z 370(M <sup>+</sup> )
116	4-[ (1-ベンジ ル-1, 2, 3, 4- -テトラヒドロ-6- キノリル) オキシ ] -3-クロロベン ゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.0-2.07(m, 2H), 2.81(t, 2H, J=6.4), 3.40(t, 2H, J=5.5Hz), 4.49(s, 2H), 6.47(d, 1H, J=8.8Hz), 6.68(dd, 1H, J=8.8, 2.9Hz), 6.72(d, 1H, J=2.9Hz), 6.82(d, 1H, J=8.3Hz), 7.24-7.36 (m, 5H), 7.39(dd, 1H, J=8.5, 2.9Hz), 7.69(d, 1H, J=2.5Hz) MS:m/z 374(M <sup>+</sup> )

【0135】

【表18】

表 1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
117	4-[(3-ベンゾ イル-1-メチル- 1H-インドール- 5-イル)オキシ] -3-クロロベンゾ ニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 3.90(s, 3H), 8.83(d, 1H, J=8.5Hz), 7.13 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.4-7.6(m, 5H), 7.61 (s, 1H), 7.7-7.8(m, 2H), 8.16(d, 1H, J=2.4Hz). MS:m/z 414(M <sup>+</sup> )
118	エチル 3-クロロ -4-[(5-イン ドリニル)オキシ] ベンゾエート	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.36-1.40(m, 3H), 3.02-3.06(m, 2H), 3.51(t, 2H, J=8.3Hz), 4.33-4.38(m, 2H), 6.62 (d, 1H, J=8.3Hz), 6.74(dd, 1H, J=8.3, 2.4Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.85(s, 1H), 7.79(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.10(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 317(M <sup>+</sup> )
119	3-クロロ-4- [(5-インドリニ ル)オキシ]ベンゾ ニトリル	融点 152-153°C NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 3.04(t, 2H, J=8.3Hz), 3.60-3.64(m, 2H), 3.80(br, 1H), 6.62(d, 1H, J=8.3Hz), 6.73(dd, 1H, J=8.3, 2.4Hz), 6.80(d, 1H, J=8.3Hz), 6.83 (t, 1H, J=1.0Hz), 7.40(dd, 1H, J=8.3, 2.0Hz), 7.70(d, 1H, J=2.4Hz) MS:m/z 270(M <sup>+</sup> )
120	4-[(1-ベンズ ヒドリル-5-イン ドリニル)オキシ] -3-クロロベンゾ エート	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.36-1.39(m, 3H), 2.93(t, 2H, J=8.3Hz), 3.23(t, 2H, J=8.3Hz), 4.32-4.37(m, 2H), 5.49 (s, 1H), 6.11(d, 1H, J=8.8Hz), 6.62(dd, 1H, J= 8.3, 2.4Hz), 6.79(d, 2H, J=8.8Hz), 7.24-7.38 (m, 10H), 7.79(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.09(d, 1H, J=2.4Hz) MS:m/z 483(M <sup>+</sup> )
121	エチル 3-クロロ -4-[(1-( α-メチルベンジル )-5-インドリニ ル)オキシ]ベンゾ エート	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.36-1.39(m, 3H), 1.54(d, 3H, J=6.8Hz), 2.94(t, 2H, J=8.3Hz), 3.34-3.47(m, 2H), 4.32- 4.37(m, 2H), 4.64-4.69(m, 1H), 6.29(d, 1H, J= 8.8Hz), 6.69(dd, 1H, J=8.3, 2.4Hz), 6.77-6.79 (m, 2H), 7.25-7.28(m, 1H), 7.33-7.37(m, 2H), 7.40-7.42(m, 2H), 7.77-7.80(m, 1H), 8.09(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 421(M <sup>+</sup> )

【0136】

【表 19】

表 1 (つづき)

参考例 番 号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
122	エチル 3-クロロ-4-[(1-フェネチル-5-インドリニル)オキシ]ベンゾエート	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.38 (t, 3H, J=7.3Hz), 2.89-2.99 (m, 4H), 3.31-3.35 (m, 2H), 3.44 (t, 2H, J=8.3Hz), 4.32-4.98 (m, 2H), 6.42 (d, 1H, J=8.8Hz), 5.77-6.82 (m, 3H), 7.21-7.27 (m, 3H), 7.30-7.34 (m, 2H), 7.78-7.81 (m, 1H), 8.10 (d, 1H, J=2.4Hz) MS: m/z 421 (M <sup>+</sup> )
123	4-[[1-(4-tert-ブチルベンジル)-5-インドリニル]オキシ]-3-クロロベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.33 (s, 9H), 2.97 (t, 2H, J=8.3Hz), 3.37 (t, 2H, J=8.3Hz), 4.23 (s, 2H), 6.48 (d, 1H, J=8.3Hz), 6.76 (dd, 1H, J=8.3, 2.4Hz), 6.80-6.83 (m, 2H), 7.29 (d, 2H, J=8.3Hz), 7.37-7.41 (m, 3H), 7.70 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 415 (M <sup>+</sup> )
124	4-[[1-(4-ビフェニルメチル)-5-インドリニル]オキシ]-3-クロロベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 3.00 (t, 2H, J=8.3Hz), 3.42 (t, 2H, J=8.3Hz), 4.30 (s, 2H), 5.50 (d, 1H, J=8.3Hz), 6.76-6.83 (m, 3H), 7.33-7.47 (m, 6H), 7.58-7.62 (m, 4H), 7.70 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 436 (M <sup>+</sup> )
125	3-クロロ-4-[[1-(4-クロロベンジル)-5-インドリニル]オキシ]ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 2.96-3.00 (m, 2H), 3.34-3.38 (m, 2H), 4.21 (s, 2H), 6.49 (d, 1H, J=8.3Hz), 6.75 (dd, 1H, J=8.3, 2.4Hz), 6.79-6.83 (m, 2H), 7.28-7.44 (m, 5H), 7.70 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 395 (M <sup>+</sup> )
126	3-クロロ-4-[[1-(3-フェニルプロピル)-5-インドリニル]オキシ]ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 1.91-1.98 (m, 2H), 2.73 (t, 2H, J=7.8Hz), 2.96 (t, 2H, J=8.3Hz), 3.07 (t, 2H, J=7.3Hz), 3.37-3.42 (m, 2H), 6.35 (d, 1H, J=8.3Hz), 6.74-6.80 (m, 3H), 7.19-7.23 (m, 3H), 7.28-7.32 (m, 2H), 7.38 (dd, 1H, J=8.3, 2.0Hz), 7.69 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 388 (M <sup>+</sup> )
127	3-クロロ-4-[[1-(3-フェノキシプロピル)-5-インドリニル]オキシ]ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ : 2.06-2.13 (m, 2H), 2.97 (t, 2H, J=8.3Hz), 3.26-3.30 (m, 2H), 3.34 (t, 2H, J=8.3Hz), 4.07-4.10 (m, 2H), 6.44 (d, 1H, J=8.3Hz), 6.78-6.79 (m, 3H), 6.91-6.97 (m, 3H), 7.26-7.31 (m, 2H), 7.37-7.39 (m, 1H), 7.69 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 404 (M <sup>+</sup> )

【0137】

【表20】

表1 (つづき)

参考例 番号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
128	3-クロロ-4-[ [1-[2-(2- エトキシフェノキシ) エチル]-5-イ ンドリニル]オキシ ]ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.42-1.45(m, 3H), 2.99(t, 2H, J=8.3Hz), 3.52-3.55(m, 2H), 3.82-3.87(m, 2H), 4.04- 4.09(m, 2H), 4.22-4.24(m, 2H), 6.54(d, 1H, J= 8.3Hz), 6.76-6.81(m, 3H), 6.89-6.93(m, 4H), 7.39(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.70(d, 1H, J=2.0 Hz) MS:m/z 434(M <sup>+</sup> )
129	3-クロロ-4-[ [1-(2-ナフチ ルメチル)-5-イ ンドリニル]オキシ ]ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.99(t, 2H, J=8.3Hz), 3.41(t, 2H, J=8.3 Hz), 4.40(s, 2H), 6.51(d, 1H, J=8.3Hz), 6.75- 6.77(m, 1H), 6.80-6.84(m, 2H), 7.39(dd, 1H, J= 8.8, 2.0Hz), 7.45-7.52(m, 3H), 7.70(d, 1H, J= 2.0Hz), 7.81-7.85(m, 4H) MS:m/z 410(M <sup>+</sup> )
130	3-クロロ-4-[ (1-シクロヘキシ ルメチル-5-イン ドリニル)オキシ] ベンゾニトリル	融点 149-150℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.92-1.01(m, 2H), 1.18-1.32(m, 3H), 1.59-1.85(m, 6H), 2.84(d, 2H, J=7.9Hz), 2.97 (t, 2H, J=8.3Hz), 3.39-3.43(m, 2H), 5.37(d, 1H, J=8.3Hz), 6.73-6.81(m, 3H), 7.38(dd, 1H, J=8.3, 2.0Hz), 7.58(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 366(M <sup>+</sup> )
131	3-クロロ-4-[ [1-(3-ピリジ ルメチル)-5-イ ンドリニル]オキシ ]ベンゾニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.99(t, 2H, J=8.3Hz), 3.37(t, 2H, J=8.3 Hz), 4.27(s, 2H), 6.47(d, 1H, J=8.3Hz), 6.76- 6.84(m, 3H), 7.30(dd, 1H, J=7.8, 4.9Hz), 7.39- 7.42(m, 1H), 7.71-7.73(m, 2H), 8.55-8.57(m, 1H), 8.63(d, 1H, J=1.5Hz) MS:m/z 381(M <sup>+</sup> )
132	3-クロロ-4-[ [1-(4-シクロ ヘキシルベンジル) -5-インドリニル ]オキシ]ベンゾニ トリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.20-1.47(m, 5H), 1.74-1.86(m, 5H), 2.51(br, 1H), 2.96(t, 2H, J=8.3Hz), 3.37(t, 2H, J=8.3Hz), 4.22(s, 2H), 6.47(d, 1H, J=8.3Hz), 6.76(dd, 1H, J=8.3, 2.4Hz), 6.80-6.82(m, 2H), 7.19(d, 2H, J=8.0Hz), 7.26-7.29(m, 2H), 7.39- 7.41(m, 1H), 7.70(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 442(M <sup>+</sup> )

【0138】

【表21】

表1 (つづき)

参考例 番号	化 学 名	理 化 学 的 性 状
133	3-クロロ-4-[ [1-(4-フェノ キシベンジル)-5 -インドリニル]オ キシ]ベンゾニト リル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.95-3.00(m, 2H), 3.37(t, 2H, J=8.3Hz), 4.22(s, 2H), 5.48(d, 1H, J=8.3Hz), 6.75-6.78 (m, 1H), 6.81(d, 2H, J=8.8Hz), 6.98-7.03(m, 4H), 7.09-7.13(m, 1H), 7.32-7.41(m, 5H), 7.70 (d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 452(M <sup>+</sup> )
134	3-クロロ-4-[ [1-[4-(4- イソプロピルフェノ キシ)ベンジル]-5 -インドリニル] オキシ]ベンゾニト リル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.25(d, 6H, J=6.8Hz), 2.87-2.99(m, 3H), 3.36(t, 2H, J=8.3Hz), 4.21(s, 2H), 6.48(d, 1H, J=8.3Hz), 6.75-6.82(m, 3H), 6.93-6.99(m, 4H), 7.19(dd, 2H, J=6.8, 2.0Hz), 7.30(d, 2H, J= 8.8Hz), 7.38-7.41(m, 1H), 7.70(d, 1H, J=2.0 Hz) MS:m/z 495(M <sup>+</sup> )
135	4-[ [1-(4- ベンジルオキシフェ ノキシ)-5-イン ドリニル]オキシ] -3-クロロベンゾ ニトリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.95(t, 2H, J=8.3Hz), 3.34(t, 2H, J=8.3 Hz), 4.18(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.47(d, 1H, J= 8.3Hz), 6.74-6.82(m, 3H), 6.94-6.98(m, 2H), 7.27-7.45(m, 8H), 7.70(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 466(M <sup>+</sup> )
136	3-クロロ-4-[ [1-(4-フェニ ルシクロヘキシル) -5-インドリニル ]オキシ]ベンゾニ トリル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.61-2.21(m, 8H), 2.25, 2.90-2.99(m, m, 合わせて8H), 3.42-3.50(m, 3H), 6.38-6.42 (m, 1H), 6.74-6.82(m, 3H), 7.19-7.41(m, 6H), 6.68-6.70(m, 1H) MS:m/z 428(M <sup>+</sup> )
137	3-クロロ-4-[ [1-(3, 4-ジ クロロベンジル)- 5-インドリニル] オキシ]ベンゾニト リル	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 3.00(t, 2H, J=8.3Hz), 3.38(t, 2H, J=8.3 Hz), 4.19(s, 2H), 6.40(d, 1H, J=8.3Hz), 6.75 (dd, 1H, J=8.3, 2.4Hz), 6.80-6.84(m, 2H), 7.21 (dd, 1H, J=8.3, 2.0Hz), 7.39-7.44(m, 2H), 7.48 (d, 1H, J=2.0Hz), 7.70(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 429(M <sup>+</sup> )
138	4-[ (2-ベンゾ イル-1-メチル- 1H-インドール- 5-イル)オキシ] -3-クロロ安息香 酸	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 4.15(s, 3H), 6.78(d, 1H, J=8.3Hz), 6.98 (s, 1H), 7.15(dd, 1H, J=9.3, 2.4Hz), 7.36(d, 1H, J=2.0Hz), 7.41(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.5- 7.6(m, 3H), 7.61(m, 1H), 7.75(d, 1H, J=2.0Hz) 7.93(m, 1H) MS:m/z 386(M <sup>+</sup> )

【0139】

【表22】

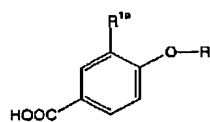


表 2

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>10</sup>	
1	4-[(1-ベンジル-1H-インドール-5-イル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		Cl	融点 158-159℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.31(s, 2H), 6.52(d, 1H, J=3.0Hz), 6.76(d, 1H, J=8.8Hz), 6.90(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.12(d, 2H, J=6.8Hz), 7.18(d, 1H, J=3.4Hz), 7.22-7.35(m, 5H), 7.81(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.18(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 377(M <sup>+</sup> )
2	3-クロロ-4-[[1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 199-200℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 6.71(d, 1H, J=3.0Hz), 6.82(d, 1H, J=8.8Hz), 7.01-7.04(m, 1H), 7.39-7.42(m, 2H), 7.60(d, 1H, J=9.3Hz), 7.62(d, 2H, J=8.3Hz), 7.81(d, 2H, J=8.8Hz), 7.86(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.21(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 431(M <sup>+</sup> )
3	3-クロロ-4-[[1-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.40(s, 2H), 6.57(d, 1H, J=3.9Hz), 6.78-6.80(m, 1H), 6.94(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.20-7.25(m, 4H), 7.32(d, 1H, J=2.4Hz), 7.58(d, 2H, J=8.3Hz), 7.83-7.85(m, 1H), 8.20(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 445(M <sup>+</sup> )

【0140】

【表23】

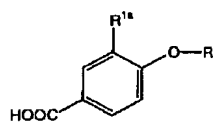


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
4	4-[(1-ベンジル-1H-インドール-6-イル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		Cl	NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.27 (s, 2H), 6.58 (d, 1H, J=9.9 Hz), 6.75 (d, 1H, J=8.8 Hz), 6.87 (dd, 1H, J=8.8, 2.0 Hz), 7.02 (d, 1H, J=2.0 Hz), 7.08-7.10 (m, 2H), 7.17 (d, 1H, J=2.9 Hz), 7.24-7.32 (m, 3H), 7.64 (d, 1H, J=8.9 Hz), 7.80 (dd, 1H, J=8.8, 2.0 Hz), 8.18 (d, 1H, J=2.0 Hz) MS: m/z 377 (M <sup>+</sup> )
5	3-クロロ-4-[(2-フェニルベンゾフラン-5-イル)オキシ]安息香酸		Cl	融点 230-231℃ NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 6.95 (d, 1H, J=8.8 Hz), 7.11-7.14 (m, 1H), 7.43-7.46 (m, 3H), 7.51-7.55 (m, 2H), 7.73 (d, 1H, J=8.8 Hz), 7.85 (dd, 1H, J=8.8, 2.0 Hz), 7.93-7.95 (m, 2H), 8.05 (d, 1H, J=2.0 Hz), 13.16 (br, 1H) MS: m/z 364 (M <sup>+</sup> )
6	4-(9H-カルバゾール-2-イルオキシ)-3-クロロ安息香酸		Cl	融点 293℃ NMR (DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 6.93 (dd, 1H, J=8.5, 2.2 Hz), 7.03 (d, 1H, J=8.8 Hz), 7.18-7.20 (m, 2H), 7.38 (t, 1H, J=7.6 Hz), 7.49 (d, 1H, J=7.8 Hz), 7.86 (dd, 1H, J=8.8, 2.0 Hz), 8.07 (d, 1H, J=2.0 Hz), 8.11 (d, 1H, J=7.8 Hz), 11.3 (s, 1H), 13.1 (s, 1H) MS: m/z 337 (M <sup>+</sup> )

【0141】

【表 2 4】

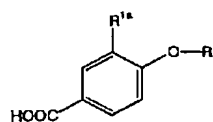


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
7	3-クロロ- 4-[(9- メチル-9H- カルバゾ- ル-2-イ ル)オキシ] 安息香酸		C1	融点 249℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 3.85(s, 1H), 6.95-6.98 (m, 2H), 7.23(t, 1H, J=7.3 Hz), 7.45-7.49(m, 2H), 7.59 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.85(d, 1H, J=9.8Hz), 8.07(d, 1H, J= 2.0Hz), 8.16(d, 1H, J=7.8 Hz), 8.22(d, 1H, J=8.3Hz), 13.1(s, 1H) MS:m/z 351(M <sup>+</sup> )
8	4-[(9- ベンジル-9 H-カルバゾ -ル-2-イ ル)オキシ] -3-クロロ 安息香酸		C1	融点 189℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 5.64(s, 2H), 6.94-6.98 (m, 2H), 7.16-7.14(m, 2H), 7.19-7.28(m, 4H), 7.41- 7.44(m, 1H), 7.50(d, 1H, J= 2.0Hz), 7.62(d, 1H, J=7.8 Hz), 7.83(dd, 1H, J=8.8, 2.0 Hz), 8.06(d, 1H, J=2.0Hz), 8.18(d, 1H, J=7.8Hz), 8.24 (d, 1H, J=8.3Hz), 13.2(s, 1H) MS:m/z 427(M <sup>+</sup> )
9	4-[(1- ベンジル-1 H-インド- ル-5-イ ル)オキシ] -3-フルオ ロ安息香酸		F	融点 173-174℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 5.44(s, 2H), 6.49(d, 1H, J=3.0Hz), 6.88(t, 1H, J=8.3 Hz), 6.94(dd, 1H, J=8.5, 2.4 Hz), 7.2-7.4(m, 4H), 7.53 (d, 1H, J=8.6Hz), 7.60(d, 1H, J=3.0Hz), 7.68(d, 1H, J= 8.6Hz), 7.79(dd, 1H, J=11.6 , 1.8Hz), 13.05(s, 1H) MS:m/z 361(M <sup>+</sup> )

【0142】

【表 2 5】



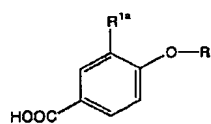


表 2 (つづき)

実施 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
10	4-[(1-ベンジル-1H-インドール-5-イル)オキシ]安息香酸		H	融点 211-213℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 5.44(s, 2H), 6.48(dd, 1H, J=5.5, 3.0Hz), 6.8-7.0(m, 3H), 7.2-7.4(m, 5H), 7.52(t, 1H, J=8.5Hz), 7.59(dd, 1H, J=6.5, 3.4Hz), 7.84(m, 2H), 7.89(d, J=9.1Hz, 1H), 12.70(br, 1H) MS:m/z 343(M <sup>+</sup> )
11	4-[(1-ベンジル-5-インドリニル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		Cl	融点 142-143℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 2.92(t, 2H, J=8.3Hz), 3.30(m, 2H), 4.28(s, 2H), 6.61(d, 1H, J=8.3Hz), 6.8-6.9(m, 3H), 7.2-7.4(m, 5H), 7.82(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.98(d, 1H, J=2.3Hz), 13.06(br, 1H) MS:m/z 379(M <sup>+</sup> )
12	4-[(3-ベンジル-1-メチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		Cl	融点 220-222℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 3.77(s, 3H), 3.99(s, 2H), 6.71(d, 1H, J=8.8Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.15(m, 1H), 7.2-7.3(m, 6H), 7.48(d, 1H, J=8.8Hz), 7.77(dd, 1H, J=8.5, 2.2Hz), 8.00(d, 1H, J=1.9Hz), 13.06(br, 1H) MS:m/z 391(M <sup>+</sup> )

【0143】

【表 2 6】

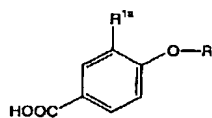


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>13</sup>	
13	3-クロロ-4-[(2-フェニル-1H-インドール-5-イル)オキシ]安息香酸		Cl	融点 268-270℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 5.84(d, 1H, J=8.8Hz), 6.89-6.92(m, 2H), 7.3-7.4(m, 2H), 7.4-7.5(m, 3H), 7.8-7.9(m, 3H), 8.02(d, 1H, J=1.9Hz), 11.72(s, 1H), 13.07(br, 1H) MS:m/z 363(M <sup>+</sup> )
14	3-クロロ-4-[(1-メチル-2-フェニル-1H-インドール-5-イル)オキシ]安息香酸		Cl	融点 260-263℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 3.79(s, 3H), 6.59(s, 1H), 6.81(d, 1H, J=8.8Hz), 7.01(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.35(d, 1H, J=2.4Hz), 7.4-7.6(m, 6H), 7.81(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.03(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 377(M <sup>+</sup> )
15	3-クロロ-4-[(4-オキソ-2-フェニル-4H-クロメン-6-イル)オキシ]安息香酸		Cl	融点 259-261℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 7.08(s, 1H), 7.24(d, 1H, J=8.6Hz), 7.46(d, 1H, J=3.1Hz), 7.58-7.69(m, 4H), 7.93-7.95(m, 2H), 8.11-8.14(m, 3H), 13.29(br, 1H) MS:n/z 393((M+1) <sup>+</sup> )
16	4-(2-ジベンゾフラニルオキシ)安息香酸		H	融点 207-208℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> 中、TMS 内部標準) δ: 7.06(2H, m), 7.33(1H, m), 7.40(1H, t), 7.56(1H, m), 7.73(1H, t), 7.79(1H, d), 7.9-8.1(3H, m), 8.17(1H, d), 12.79(1H, s) MS:m/z 304(M <sup>+</sup> )

【0144】

【表 27】

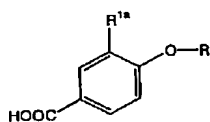


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
17	3-クロロ-4-[(1-メチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]安息香酸		C1	融点 199-201℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 3.83(s, 3H), 6.43(d, 1H, J=2.4Hz), 6.77(d, 1H, J=8.8Hz), 6.96(dd, 1H, J=8.8, 2.2Hz), 7.32(d, 1H, J=2.4Hz), 7.42(d, 1H, J=2.9Hz), 7.53(d, 1H, J=8.8Hz), 7.79(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.02(d, 1H, J=2.0Hz), 13.07(br, 1H) MS: m/z 301(M <sup>+</sup> )
18	4-[(3-ベンゾイル-1-メチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		C1	融点 242-243℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 3.92(s, 3H), 6.92(d, 1H, J=8.3Hz), 7.19(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.5-7.6(m, 3H), 7.71(d, 1H, J=8.8Hz), 7.8-7.9(m, 4H), 8.06(d, J=2.0Hz), 8.12(s, 1H) MS: m/z 405(M <sup>+</sup> )
19	4-[(2-ベンジル-1-メチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		C1	融点 198-201℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 3.65(s, 3H), 4.18(s, 2H), 6.16(s, 1H), 6.77(d, 1H), 6.89(dd, 1H), 7.2-7.4(m, 6H), 7.47(d, 1H), 7.76(dd, 1H), 8.00(d, 1H), 13.05(br, 1H) MS: m/z 391(M <sup>+</sup> )

【0145】

【表 28】

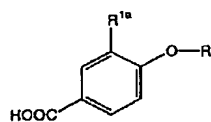


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
20	4-[(2-ベンジル-1H-インドール-5-イル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		Cl	融点 185-188℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 4.07(s, 2H), 6.16(s, 1H), 6.75(d, 2H, J=8.8Hz), 6.80(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.21(d, 1H, J=2.4Hz), 7.23(m, 1H), 7.3-7.4(m, 4H), 7.76(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.00(d, 1H, J=2.4Hz), 11.18(s, 1H), 13.04(brs, 1H) MS:m/z 377 (M <sup>+</sup> )
21	4-[(2-ベンゾイル-1H-インドール-5-イル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		Cl	融点 218-220℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 6.84(d, 1H, J=8.8Hz), 7.0-7.1(m, 2H), 7.40(d, 1H, J=2.0Hz), 7.5-7.7(m, 3H), 7.79(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.94(m, 2H), 8.04(d, 1H, J=2.4Hz), 8.15(s, 1H), 12.07(s, 1H), 12.85(br, 1H) MS:m/z 391 (M <sup>+</sup> )
22	4-[(2-ベンゾイル-1-メチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		Cl	融点 226-228℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 4.08(s, 3H), 6.86(d, 1H, J=8.8Hz), 7.01(s, 1H), 7.26(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.48(d, 1H, J=2.5Hz), 7.58(dd, 2H, J=7.8, 7.3Hz), 7.70(t, 1H, J=7.3Hz), 7.77(d, 1H, J=9.3Hz), 7.8-7.9(m, 3H), 8.03(d, 1H, J=2.0Hz), 13.13(br, 1H) MS:m/z 405 (M <sup>+</sup> )

【0146】

【表2-9】

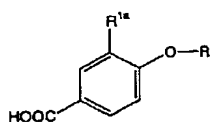


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
23	3-クロロ-4-[[1-(4-イソブチルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	融点 144-145℃ NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 0.88 (d, 6H, J=6.8Hz), 1.80-1.87 (m, 1H), 2.44 (d, 2H, J=7.3Hz), 5.29 (s, 2H), 6.51 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.78 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.92 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.05 (d, 2H, J=8.3Hz), 7.09 (d, 2H, J=8.3Hz), 7.19 (d, 1H, J=3.4Hz), 7.30 (d, 1H, J=8.8Hz), 3.55 (d, 1H, J=2.4Hz), 7.82 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.19 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 433 (M <sup>+</sup> )
24	3-クロロ-4-[[1-(4-イソブチルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 1.23 (d, 6H, J=7.3Hz), 2.89 (septet, 1H, J=6.8Hz), 5.31 (s, 2H), 6.52 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.79 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.93 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.08 (d, 2H, J=7.8Hz), 7.16-7.22 (m, 3H), 7.30-7.38 (m, 2H), 7.80-7.85 (m, 1H), 8.17-8.21 (m, 1H) MS: m/z 419 (M <sup>+</sup> )
25	4-[[1-(4-tert-ブチルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]-3-クロロ安息香酸		C1	融点 112-114℃ NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 1.29 (s, 9H), 5.29 (s, 2H), 6.51 (d, 1H, J=3.4Hz), 6.78 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.92 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.07 (d, 2H, J=8.3Hz), 7.18 (d, 1H, J=2.9Hz), 7.30-7.35 (m, 4H), 7.82 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.19 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 433 (M <sup>+</sup> )

【0147】

【表30】

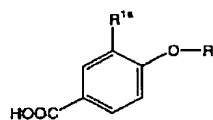


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>13</sup>	
26	3-クロロ-4-[[1-(3-フェニルプロピル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.43 (s, 6H), 2.19-2.22 (m, 2H), 3.83-3.92 (m, 2H), 6.42 (d, 1H, J=3.4Hz), 6.75 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.90 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.01-7.09 (m, 2H), 7.24-7.33 (m, 2H), 7.97-7.47 (m, 4H), 7.82 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.19 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 433 (M <sup>+</sup> )
27	3-クロロ-4-[[1-(フェネチル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	融点 170-173°C NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 3.13 (t, 2H, J=7.3Hz), 4.37 (t, 2H, J=7.3Hz), 6.43 (d, 1H, J=3.4Hz), 6.77 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.94 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.01 (d, 1H, J=2.9Hz), 7.08 (d, 2H, J=6.4Hz), 7.23-7.36 (m, 5H), 7.80-7.86 (m, 1H), 8.19 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 391 (M <sup>+</sup> )
28	3-クロロ-4-[[1-(3-フェニルプロピル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.22 (quintet, 2H, J=7.3Hz), 2.62-2.71 (m, 2H), 4.11-4.20 (m, 2H), 6.48 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.78 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.95 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.13-7.38 (m, 8H), 7.81-7.87 (m, 1H), 8.20 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 405 (M <sup>+</sup> )

【0148】

【表 3 1】

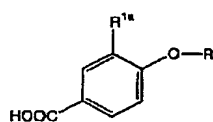


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R¹⁸	
29	3-クロロ-4-[[1-(4-フェニルブチル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 151-152℃ NMR(CDCl₃) δ: 1.63-1.73(m, 2H), 1.85-1.95(m, 2H), 2.61-2.68(m, 2H), 4.11-4.18(m, 2H), 6.46(d, 1H, J=2.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.95(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.11-7.22(m, 4H), 7.24-7.37(m, 4H), 7.83 dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.20(d, 1H, J=2.5Hz) MS:m/z 419(M⁺)
30	4-[[1-(4-ピフェニルメチル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]-3-クロロ安息香酸		Cl	融点 200-203℃ NMR(CDCl₃) δ: 5.39(s, 2H), 6.56(d, 1H, J=2.9Hz), 6.80(d, 1H, J=8.8Hz), 6.95(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.19-7.28(m, 3H), 7.31-7.39(m, 3H), 7.50-7.57(m, 2H), 7.53-7.59(m, 4H), 7.81-7.86(m, 1H), 8.18(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 453(M⁺)
31	3-クロロ-4-[(1-シクロヘキシルメチル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 111-113℃ NMR(CDCl₃) δ: 0.97-1.06(m, 2H), 1.12-1.30(m, 8H), 1.63-1.74(m, 5H), 1.84-1.88(m, 1H), 8.95(d, 2H, J=7.8Hz), 6.46(d, 1H, J=2.4Hz), 6.80(d, 1H, J=8.8Hz), 6.95(d, 1H, J=8.8Hz), 7.13(d, 1H, J=2.5Hz), 7.33(s, 1H), 7.34(d, 1H, J=8.8Hz), 7.83(d, 1H, J=8.8Hz), 8.20(2, 1H) MS:m/z 383(M⁺)

【0149】

【表 3 2】

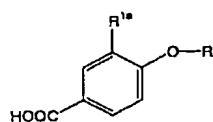


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
32	3-クロロ-4-[[1-(2-シクロヘキシルエチル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 152-154℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.93-1.08 (m, 2H), 1.11-1.38 (m, 4H), 1.62-1.83 (m, 7H), 4.11-4.20 (m, 2H), 6.47 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.78 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.96 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.16 (d, 1H, J=2.9Hz), 7.32-7.38 (m, 2H), 7.83 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.20 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 397 (M <sup>+</sup> )
33	3-クロロ-4-[[1-(3-フェノキシプロピル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.26-2.37 (m, 2H), 3.85-3.94 (m, 2H), 4.37-4.45 (m, 2H), 6.46 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.75 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.85-7.01 (m, 4H), 7.25-7.41 (m, 4H), 7.81 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.19 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 421 (M <sup>+</sup> )
34	3-クロロ-4-(1H-インドール-5-イル)オキシ安息香酸		Cl	融点 228-230℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 6.48-6.49 (m, 1H), 6.75 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.89-6.92 (m, 1H), 7.27-7.31 (m, 2H), 7.41-7.46 (m, 1H), 7.76-7.79 (m, 1H), 8.12 (d, 1H, J=2.0Hz), 10.10 (br. 1H) MS: m/z 287 (M <sup>+</sup> )

【0150】

【表 3 3】



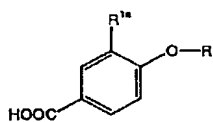


表 2 (つづき)

実施 例 番 号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
35	3-クロロ-4-[[1-(2-クロロベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	融点 174-175℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.44(s, 2H), 6.57(d, 1H, J=3.4Hz), 6.67(d, 1H, J=7.8Hz), 6.80(d, 1H, J=8.6Hz), 6.95(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.11-7.18(m, 1H), 7.19-7.31(m, 3H), 7.37(d, 1H, J=2.4Hz), 7.43(d, 1H, J=7.8Hz), 7.80-7.88(m, 1H), 8.19(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 411(M <sup>+</sup> )
36	3-クロロ-4-[[1-(3-クロロベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	融点 191-194℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.32(s, 2H), 5.55(d, 1H, J=3.4Hz), 6.80(d, 1H, J=8.8Hz), 6.92-7.04(m, 2H), 7.14(s, 1H), 7.17-7.33(m, 4H), 7.36(d, 1H, J=2.4Hz), 7.61-7.88(m, 1H), 8.20(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 411(M <sup>+</sup> )
37	3-クロロ-4-[[1-(4-クロロベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.31(s, 2H), 6.54(d, 1H, J=3.4Hz), 6.78(d, 1H, J=8.3Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.06(d, 2H, J=8.3Hz), 7.18(d, 1H, J=2.9Hz), 7.22-7.33(m, 3H), 7.36(d, 1H, J=2.0Hz), 7.83(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.19(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 411(M <sup>+</sup> )

【0151】

【表34】

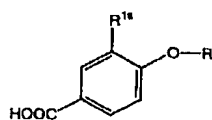


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>18</sup>	
38	3-クロロ-4-[[1-(2-メチルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 195-197℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.32 (s, 3H), 5.30 (s, 2H), 6.52 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.77-6.83 (m, 2H), 6.94 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.06-7.16 (m, 2H), 7.21-7.33 (m, 3H), 7.37 (d, 1H, J=2.0Hz), 7.81-7.88 (m, 1H), 8.20 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 391 (M <sup>+</sup> )
39	3-クロロ-4-[[1-(3-メチルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 182-184℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.32 (s, 3H), 5.30 (s, 2H), 6.53 (d, 1H, J=2.4Hz), 6.87 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.90-7.00 (m, 3H), 7.10 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.17-7.24 (m, 2H), 7.30 (d, 1H, J=8.8Hz), 7.35 (d, 1H, J=2.5Hz), 7.83 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.19 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 391 (M <sup>+</sup> )
40	3-クロロ-4-[[1-(4-メチルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 160-162℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.33 (s, 3H), 5.30 (s, 2H), 6.52 (d, 1H, J=2.4Hz), 6.78 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.82 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.05 (d, 1H, J=8.3Hz), 7.13 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.19 (d, 1H, J=2.9Hz), 7.30 (d, 1H, J=8.8Hz), 7.35 (d, 1H, J=2.4Hz), 7.82 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.19 (d, 1H, J=2.4Hz) MS: m/z 391 (M <sup>+</sup> )

【0152】

【表35】

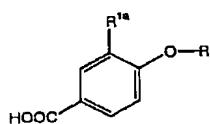


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
41	3-クロロ-4-[[1-(5-フェニルペンチル)-1H-インドル-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	融点 144-145℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.33-1.45(m, 2H), 1.51-1.73(m, 2H), 1.83-1.95(m, 2H), 2.60(t, 2H, J=7.8Hz), 4.08-4.17(m, 2H), 6.46(d, 1H, J=2.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.3Hz), 6.96(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 4.11-4.22(m, 8H), 4.24-4.38(m, 4H), 7.83(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.20(d, 1H, J=2.4Hz) MS: m/z 433(M <sup>+</sup> )
42	3-クロロ-4-[[1-(6-フェニルヘキシル)-1H-インドル-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.30-1.44(m, 4H), 1.55-1.67(m, 2H), 1.78-1.91(m, 2H), 2.53-2.62(m, 2H), 4.08-4.15(m, 2H), 6.46(d, 1H, J=2.9Hz), 6.77(d, 1H, J=8.8Hz), 6.95(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.11-7.21(m, 4H), 7.23-7.37(m, 4H), 7.82(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.20(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 447(M <sup>+</sup> )
43	3-クロロ-4-[[1-(4-フルオロベンジル)-1H-インドル-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.31(s, 2H), 6.54(d, 1H, J=3.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.01(t, 2H, J=8.8Hz), 7.07-7.16(m, 2H), 7.18(d, 1H, J=2.9Hz), 7.23-7.29(m, 1H), 7.35(d, 1H, J=2.0Hz), 7.83(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.20(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 395(M <sup>+</sup> )

【0153】

【表36】

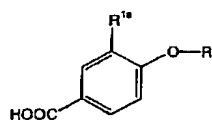


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>18</sup>	
44	4-[[1-(4-プロモベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]-3-クロロ安息香酸		C1	NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.29(s, 2H), 6.54(d, 1H, J=3.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.00(d, 2H, J=8.3Hz), 7.18(d, 1H, J=2.9Hz), 7.24(d, 1H, J=8.8Hz), 7.36(d, 1H, J=2.4Hz), 7.45(d, 2H, J=8.8Hz), 7.83(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.20(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 457 (M <sup>+</sup> )
45	3-クロロ-4-[[1-(4-メトキシベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	融点 173-176℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 3.79(s, 3H), 5.27(s, 2H), 6.51(d, 1H, J=2.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.86(dd, 2H, J=6.6, 2.4Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.10(d, 2H, J=8.8Hz), 7.18(d, 1H, J=3.4Hz), 7.28-7.37(m, 2H), 7.82(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.19(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 407 (M <sup>+</sup> )
46	3-クロロ-4-[[1-(4-シクロヘキシルベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.17-1.46(m, 5H), 1.69-1.90(m, 5H), 2.42-2.53(m, 1H), 5.30(s, 2H), 6.52(d, 1H, J=2.9Hz), 6.79(d, 1H, J=8.8Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.07(d, 2H, J=7.8Hz), 7.13-7.22(m, 3H), 7.29-7.38(m, 2H), 7.80-7.86(m, 1H), 8.19(d, 1H, J=2.4Hz) MS: m/z 459 (M <sup>+</sup> )

【0154】

【表 37】

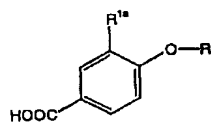


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
47	4-[ [1-(4-(1-アダマンチル)ベンジル)-1H-インドール-5-イル] オキシ] -3-クロロ安息香酸		C1	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 1.68-1.96(m, 12H), 2.03-2.13(m, 3H), 5.30(s, 2H), 6.52(d, 1H, J=3.4Hz), 6.79(d, 1H, J=8.8Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.10(d, 2H, J=8.8Hz), 7.19(d, 1H, J=2.9Hz), 7.27-7.38(m, 4H), 7.83(d, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 8.20(d, 1H, J=2.5Hz) MS:m/z 511 (M <sup>+</sup> )
48	3-クロロ-4-[ (1-ナフチルメチル)-1H-インドール-5-イル] オキシ] 安息香酸		C1	融点 241-244℃ NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 5.80(s, 2H), 6.54(d, 1H, J=3.4Hz), 6.83(d, 1H, J=8.8Hz), 6.93-6.99(m, 2H), 7.13(d, 1H, J=2.9Hz), 7.34-7.43(m, 3H), 7.51-7.59(m, 2H), 7.81-8.02(m, 4H), 8.20(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 427 (M <sup>+</sup> )
49	4-[ [1-(3-ピフェニルメチル)-1H-インドール-5-イル] オキシ] -3-クロロ安息香酸		C1	NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 5.41(s, 2H), 6.55(d, 1H, J=2.9Hz), 6.79(d, 1H, J=8.8Hz), 6.94(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.11(d, 1H, J=7.8Hz), 7.22-7.57(m, 11H), 7.79-7.86(m, 1H), 8.19(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 453 (M <sup>+</sup> )

【0155】

【表38】

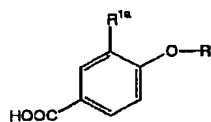


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
50	4-[[1-(2-ピフェニルメチル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]-3-クロロ安息香酸		C1	融点 192-196℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.28(s, 2H), 6.46(d, 1H, J=3.4Hz), 6.75(d, 1H, J=8.8Hz), 6.85(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 6.93-7.08(m, 3H), 7.22-7.47(m, 9H), 7.82(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.18(d, 1H, J=2.4Hz) MS:m/z 453(M <sup>+</sup> )
51	3-クロロ-4-[[1-(3-シクロヘキシルプロピル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.80-0.98(m, 2H), 1.06-1.32(m, 6H), 1.58-1.77(m, 5H), 1.80-1.94(m, 2H), 4.11(t, 2H, J=7.3Hz), 6.47(d, 1H, J=2.5Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.96(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.16(d, 1H, J=2.9Hz), 7.30-7.39(m, 2H), 7.83(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 8.20(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 411(M <sup>+</sup> )
52	3-クロロ-4-[[1-(4-シクロヘキシルブチル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.78-0.92(m, 2H), 1.06-1.40(m, 8H), 1.58-1.78(m, 5H), 1.84(quintet, 2H, J=7.3Hz), 4.08-4.17(m, 2H), 6.47(d, 1H, J=2.9Hz), 6.78(d, 1H, J=8.8Hz), 6.96(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.16(d, 1H, J=2.9Hz), 7.32-7.39(m, 2H), 7.80-7.86(m, 1H), 8.19(d, 1H, J=2.4Hz) MS:m/z 425(M <sup>+</sup> )

【0156】

【表39】

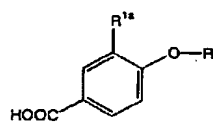


表 2 (つづき)

実施 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
53	3-クロロ-4-[(1-シクロヘプチルメチル-1H-インドール-5-イル)オキシ]安息香酸		Cl	NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.18-1.30 (m, 2H), 1.94-1.73 (m, 10H), 2.03-2.16 (m, 1H), 3.94 (d, 2H, J=7.3Hz), 6.45 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.80 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.95 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.14 (d, 1H, J=3.4Hz), 7.30-7.38 (m, 2H), 7.83 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 8.19 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 397 (M <sup>+</sup> )
54	3-クロロ-4-[[1-(4-ピリジルメチル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 173-175℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.40 (s, 2H), 6.57 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.78 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.92 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.01 (d, 2H, J=5.9Hz), 7.18-7.28 (m, 2H), 7.34 (d, 1H, J=2.4Hz), 7.79 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.12 (d, 1H, J=2.0Hz), 8.54 (d, 2H, J=4.9Hz) MS: m/z 378 (M <sup>+</sup> )
55	3-クロロ-4-[(1-イソアミル-1H-インドール-5-イル)オキシ]安息香酸		Cl	NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.99 (d, 6H, J=6.8Hz), 1.57-1.70 (m, 1H), 1.72-1.80 (m, 2H), 4.11-4.20 (m, 2H), 6.47 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.79 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.96 (dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 7.17 (d, 1H, J=3.4Hz), 7.31-7.40 (m, 2H), 7.83 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.20 (d, 1H, J=2.4Hz) MS: m/z 357 (M <sup>+</sup> )

【0157】

【表40】

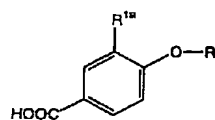


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
56	8-クロロ-4-[[1-(4-フェノキシベンジル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 213-216℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.91(s, 2H), 6.53(d, 1H, J=2.4Hz), 6.79(d, 1H, J=8.8Hz), 6.89-7.40(m, 13H), 7.82(d, 1H, J=6.8Hz), 8.19(s, 1H) MS:m/z 469(M <sup>+</sup> )
57	3-クロロ-4-[[1-[4-(フェニルエチニル)ベンジル]-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 220-227℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 5.95(s, 2H), 6.55(d, 1H, J=3.4Hz), 6.79(d, 1H, J=8.3Hz), 6.93(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.11(d, 2H, J=8.3Hz), 7.21(d, 1H, J=3.4Hz), 7.23-7.39(m, 5H), 7.45-7.58(m, 4H), 7.81-7.87(m, 1H), 8.19(d, 1H, J=2.5Hz) MS:m/z 477(M <sup>+</sup> )
58	3-クロロ-4-[[1-(シクロペンチルメチル)-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 161-163℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.22-1.38(m, 2H), 1.51-1.80(m, 6H), 2.38-2.53(m, 1H), 4.05(d, 2H, J=7.3Hz), 6.46(d, 1H, J=2.9Hz), 6.79(d, 1H, J=8.8Hz), 6.95(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.18(d, 1H, J=2.9Hz), 7.30-7.42(m, 2H), 7.83(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.20(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 369(M <sup>+</sup> )

【0158】

【表 4-1】



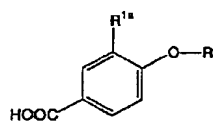


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
59	3-クロロ-4-[[2-(4-イソプロピルフェニル)-1-メチル-1H-インドール-5-イル]オキシ]安息香酸		C1	融点 230-233℃ NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 2.64(d, 6H, J=8.8Hz), 2.99-3.06(m, 1H), 3.78(s, 3H), 6.52(d, 1H, J=3.4Hz), 6.79(d, 1H, J=8.8Hz), 7.00(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 7.32-7.41(m, 4H), 7.45(d, 2H, J=8.3Hz), 7.82(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.19(d, 1H, J=2.4Hz) MS:m/z 419(M <sup>+</sup> )
60	4-[[1-(4-ピフェニルメチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル]オキシ]-3-クロロ安息香酸		C1	融点 221-222℃ NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 2.43(s, 3H), 5.37(s, 2H), 6.34(s, 1H), 6.79(d, 1H, J=8.8Hz), 6.86-6.88(m, 1H), 7.06(d, 2H, J=8.3Hz), 7.23-7.29(m, 2H), 7.32-7.35(m, 1H), 7.40-7.44(m, 2H), 7.51-7.56(m, 4H), 7.82(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.19(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 467(M <sup>+</sup> )
61	3-クロロ-4-(5-インドリニルオキシ)安息香酸		C1	融点 205-207℃ NMR(CDC1 <sub>3</sub> ) δ: 2.92-2.95(m, 2H), 3.44-3.47(m, 2H), 6.54(d, 1H, J=8.6Hz), 6.71(dd, 1H, J=7.9, 2.4Hz), 6.81(d, 1H, J=8.5Hz), 6.85(d, 1H, J=2.4Hz), 7.82(dd, 1H, J=8.5, 1.9Hz), 7.99(d, 1H, J=1.8Hz) MS:m/z 289(M <sup>+</sup> )

【0159】

【表 4 2】

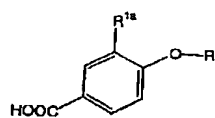


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
62	4-[(1-ベンズヒドリル-5-インドリニル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		C1	融点 122-123℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.92-2.96(m, 2H), 3.24(t, 2H, J=8.3Hz), 5.50(s, 1H), 6.12(d, 1H, J=8.8Hz), 6.63(dd, 1H, J=8.3, 2.4Hz), 6.80-6.82(m, 2H), 7.25-7.38(m, 10H), 7.84(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.15(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 455(M <sup>+</sup> )
63	3-クロロ-4-[[1-(α-メチルベンジル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		C1	融点 123-125℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.55(d, 3H, J=6.8Hz), 2.95(t, 2H, J=8.3Hz), 3.36-3.48(m, 2H), 4.65-4.70(m, 1H), 6.30(d, 1H, J=8.3Hz), 6.71(dd, 1H, J=8.3, 2.4Hz), 6.75-6.81(m, 2H), 7.22-7.42(m, 5H), 7.84(dd, 1H, J=8.8, 2.4Hz), 8.15(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 393(M <sup>+</sup> )
64	3-クロロ-4-[(1-フェネチル-5-インドリニル)オキシ]安息香酸		C1	融点 161-163℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.89-2.93(m, 2H), 2.98(t, 2H, J=7.8Hz), 3.21-3.36(m, 2H), 3.45(t, 2H, J=8.3Hz), 6.44(d, 1H, J=8.3Hz), 6.78-6.83(m, 3H), 7.22-7.34(m, 5H), 7.84-7.86(m, 1H), 8.16(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 393(M <sup>+</sup> )

【0160】

【表 4 3】

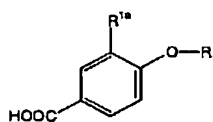


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
65	3-クロロ-4-[[1-(4-イソプロピルベンジル)-5-インドリル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 109-111℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.25 (d, 6H, J=7.3Hz), 2.88-2.98 (m, 3H), 3.35 (t, 2H, J=8.3Hz), 4.22 (s, 2H), 5.49 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.77-6.84 (m, 3H), 7.21 (d, 2H, J=8.8Hz), 7.29 (d, 2H, J=8.3Hz), 7.84-7.87 (m, 1H), 8.17 (d, 1H, J=2.4Hz) MS: m/z 421 (M <sup>+</sup> )
66	3-クロロ-4-[[1-(4-イソプロチルベンジル)-5-インドリル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 129-130℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.91 (d, 6H, J=6.8Hz), 1.83-1.90 (m, 1H), 2.47 (d, 2H, J=7.3Hz), 2.94-2.98 (m, 2H), 3.35 (t, 2H, J=8.3Hz), 4.22 (s, 2H), 5.49 (d, 1H, J=8.3Hz), 6.78-6.84 (m, 3H), 7.12 (d, 2H, J=7.8Hz), 7.27 (d, 2H, J=7.8Hz), 7.85 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.17 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 435 (M <sup>+</sup> )
67	3-クロロ-4-[[1-(2-フルオレニルメチル)-5-インドリル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 216-218℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.99 (t, 2H, J=8.3Hz), 3.40 (t, 2H, J=8.3Hz), 3.91 (s, 2H), 4.32 (s, 2H), 6.52 (d, 1H, J=8.3Hz), 5.78-5.86 (m, 3H), 7.30 (t, 1H, J=7.3Hz), 7.38 (t, 2H, J=7.3Hz), 7.54-7.57 (m, 2H), 7.78 (t, 2H, J=7.8Hz), 7.85 (dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.16 (d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 467 (M <sup>+</sup> )

【0161】

【表 4 4】

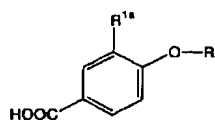


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>13</sup>	
68	3-クロロ-4-[[1-(2-シクロヘキシルエチル)-5-インドリル]オキシ]安息香酸		C1	融点 135-136℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.93-1.02 (m, 2H), 1.12-1.42 (m, 4H), 1.50 (dd, 2H, J=15.0, 6.8 Hz), 1.65-1.78 (m, 5H), 2.95 (t, 2H, J=8.3 Hz), 3.06-3.10 (m, 2H), 3.36-3.40 (m, 2H), 6.44 (d, 1H, J=8.3 Hz), 6.75-6.84 (m, 3H), 7.84 (dd, 1H, J=8.8, 2.0 Hz), 8.16 (d, 1H, J=2.0 Hz) MS: m/z 399 (M <sup>+</sup> )
69	4-[[4-(tert-ブチルベンジル)-5-インドリル]オキシ]-3-クロロ安息香酸		C1	融点 88-90℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.33 (s, 9H), 2.96 (t, 2H, J=8.3 Hz), 3.36 (t, 2H, J=8.3 Hz), 4.23 (s, 2H), 6.50 (d, 1H, J=8.8 Hz), 6.77-6.84 (m, 3H), 7.29 (d, 2H, J=8.3 Hz), 7.37 (d, 2H, J=8.3 Hz), 7.85 (dd, 1H, J=8.8, 2.0 Hz), 8.17 (d, 1H, J=2.0 Hz) MS: m/z 435 (M <sup>+</sup> )
70	4-[[1-(4-ピフェニルメチル)-5-インドリル]オキシ]-3-クロロ安息香酸		C1	融点 185-186℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 3.00 (t, 2H, J=8.3 Hz), 3.99-4.43 (m, 2H), 4.29 (s, 2H), 6.51 (d, 1H, J=8.8 Hz), 6.79-6.86 (m, 3H), 7.30-7.37 (m, 1H), 7.44-7.46 (m, 4H), 7.58-7.62 (m, 4H), 7.86-7.88 (m, 1H), 8.17 (d, 1H, J=2.0 Hz) MS: m/z 455 (M <sup>+</sup> )

【0162】

【表 4 5】

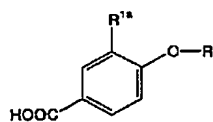


表 2 (つづき)

実施 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
71	3-クロロ-4-[[1-(4-クロロベンジル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		C1	融点 168-169℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.96-3.00(m, 2H), 3.35(t, 2H, J=8.3Hz), 4.21(s, 2H), 6.44(d, 1H, J=8.3Hz), 6.77-6.86(m, 3H), 7.32(s, 4H), 7.85(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.17(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 414(M <sup>+</sup> )
72	3-クロロ-4-[[1-(3-フェニルプロピル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		C1	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.42-1.99(m, 2H), 2.72-2.76(m, 2H), 2.97(t, 2H, J=8.3Hz), 3.06-3.09(m, 2H), 3.39(t, 2H, J=8.3Hz), 6.37(d, 1H, J=8.3Hz), 6.77-6.82(m, 3H), 7.17-7.33(m, 5H), 7.84(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.16(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 407(M <sup>+</sup> )
73	3-クロロ-4-[[1-(3-フェノキシプロピル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		C1	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.07-2.14(m, 2H), 2.95-2.99(m, 2H), 3.27-3.30(m, 2H), 3.43(t, 2H, J=8.3Hz), 4.08-4.11(m, 2H), 6.46(d, 1H, J=8.3Hz), 6.73-6.82(m, 3H), 6.88(m, 3H), 7.26-7.31(m, 2H), 7.84(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.15(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 423(M <sup>+</sup> )

【0163】

【表 46】

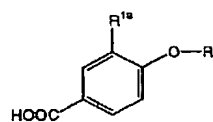


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
74	3-クロロ-4-[[1-(2-エトキシフェノキシ)エチル]-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		C1	融点 152-153℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.41-1.46(m, 3H), 3.00(t, 2H, J=8.3Hz), 3.53-3.56(m, 2H), 3.65(t, 2H, J=8.3Hz), 4.00-4.12(m, 2H), 4.23-4.28(m, 2H), 5.57(d, 1H, J=8.3Hz), 6.75-6.98(m, 7H), 7.81-7.86(m, 1H), 8.16(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 453 (M <sup>+</sup> )
75	3-クロロ-4-[[1-(2-ナフチルメチル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		C1	融点 182-183℃ NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.98-3.02(m, 2H), 3.40(t, 2H, J=8.3Hz), 4.41(s, 2H), 6.52(d, 1H, J=8.3Hz), 6.78-6.87(m, 3H), 7.45-7.53(m, 3H), 7.62(m, 5H), 8.17(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 429 (M <sup>+</sup> )
76	3-クロロ-4-[[1-(シクロヘキシルメチル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		C1	NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 0.93-1.02(m, 2H), 1.18-1.32(m, 3H), 1.59-1.86(m, 6H), 2.84(d, 2H, J=6.8Hz), 2.97(t, 2H, J=8.3Hz), 3.38-3.43(m, 2H), 6.38(d, 1H, J=8.3Hz), 6.76-6.81(m, 3H), 7.84(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.16(d, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 385 (M <sup>+</sup> )

【0164】

【表 4】

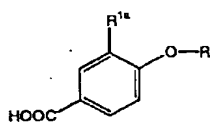


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R <sup>1a</sup>	
77	3-クロロ-4-[[1-(3-ピリジルメチル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		C1	融点 226-228℃ NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ: 2.98(t, 2H, J=8.3Hz), 3.35(t, 2H, J=8.8Hz), 4.31(s, 2H), 6.59(d, 1H, J=8.8Hz), 6.76-6.86(m, 3H), 7.33-7.38(m, 1H), 7.74-7.80(m, 1H), 7.74-7.80(m, 2H), 7.99(d, 1H, J=2.0Hz), 8.49(dd, 1H, J=4.9, 1.5Hz), 8.59(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 380(M <sup>+</sup> )
78	3-クロロ-4-[[1-(4-シクロヘキシルベンジル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		C1	融点 119-121℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 1.21-1.47(m, 5H), 1.73-1.87(m, 5H), 2.50(br, 1H), 2.96(t, 2H, J=8.3Hz), 3.36(t, 2H, J=8.3Hz), 4.22(s, 2H), 6.49(d, 1H, J=8.3Hz), 6.77-6.83(m, 3H), 7.19(d, 2H, J=8.3Hz), 7.28(d, 2H, J=7.8Hz), 7.84-7.87(m, 1H), 8.17(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 461(M <sup>+</sup> )
79	3-クロロ-4-[[1-(4-フェノキシベンジル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		C1	融点 164-165℃ NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ: 2.97(t, 2H, J=8.3Hz), 3.36(t, 2H, J=8.3Hz), 4.22(s, 2H), 6.50(d, 1H, J=8.8Hz), 6.78-6.85(m, 3H), 6.94-7.07(m, 4H), 7.10(t, 1H, J=7.3Hz), 7.32-7.36(m, 4H), 7.83-7.87(m, 1H), 8.17(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 471(M <sup>+</sup> )

【0165】

【表48】

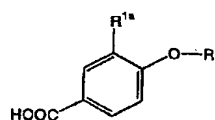


表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	H¹ᵃ	
80	3-クロロ-4-[[1-(4-イソプロピルフェノキシ)ベンジル]-5-インドリニル]オキシ安息香酸		Cl	融点 134-136℃ NMR(CDCl₃) δ: 1.25(d, 6H, J=7.3Hz), 2.89-2.99(m, 3H), 3.36(t, 2H, J=8.3Hz), 4.22(s, 2H), 6.50(d, 1H, J=8.3Hz), 6.78-6.84(m, 3H), 6.94-6.99(m, 4H), 7.19(dd, 2H, J=6.8, 2.0Hz), 7.31(d, 2H, J=8.3Hz), 7.85(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.17(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 514(M⁺)
81	4-[[1-(4-ベンジルオキシベンジル)-5-インドリニル]オキシ]-3-クロロ安息香酸		Cl	融点 116-118℃ NMR(CDCl₃) δ: 2.95(t, 2H, J=8.3Hz), 3.32(t, 2H, J=8.3Hz), 4.19(s, 2H), 5.07(s, 2H), 6.49(d, 1H, J=8.3Hz), 6.77-6.84(m, 3H), 6.95-6.98(m, 2H), 7.28-7.45(m, 7H), 7.85(dd, 1H, J=8.8, 2.0Hz), 8.17(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 485(M⁺)
82	3-クロロ-4-[[1-(3,4-ジクロロベンジル)-5-インドリニル]オキシ]安息香酸		Cl	融点 187-188℃ NMR(CDCl₃) δ: 3.00(t, 2H, J=8.3Hz), 3.37(t, 2H, J=8.3Hz), 4.19(s, 2H), 6.41(d, 1H, J=8.8Hz), 6.77-6.82(m, 2H), 6.86(d, 1H, J=2.5Hz), 7.21-7.23(m, 1H), 7.42(d, 1H, J=7.8Hz), 7.49(d, 1H, J=2.0Hz), 7.85-7.88(m, 1H), 8.17(d, 1H, J=2.0Hz) MS:m/z 448(M⁺)

【0166】

【表 49】



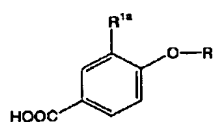


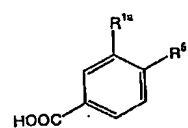
表 2 (つづき)

実施 例 番号	化学名	構 造 式		理化学的性状
		- R	R¹⁸	
83	3-クロロ-4-[[1-(4-フェニルシクロヘキシル)-6-インドリニル]オキシ]安息香酸		Cl	NMR (CDCl₃) δ: 1.59-2.22 (m, 8H), 2.55, 2.90-3.00 (m, m, 合わせて 3H), 3.41-3.50 (m, 3H), 6.40-6.44 (m, 1H), 6.76-6.82 (m, 3H), 7.19-7.36 (m, 5H), 7.83-7.86 (m, 1H), 8.16 (t, 1H, J=2.0Hz) MS: m/z 447 (M⁺)
84	4-[(1-ベンジル-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリル)オキシ]-3-クロロ安息香酸		Cl	融点 146-162℃ NMR (CDCl₃) δ: 2.00-2.06 (m, 2H), 2.81 (t, 2H, J=2.8Hz), 3.39 (t, 2H, J=5.6Hz), 4.49 (s, 2H), 6.48 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.70 (dd, 1H, J=8.8, 2.9Hz), 6.74 (d, 1H, J=2.9Hz), 6.82 (d, 1H, J=8.3Hz), 7.24-7.36 (m, 5H), 7.85 (dd, 1H, J=8.5, 2.2Hz), 8.16 (d, 1H, J=2.4Hz) MS: m/z 393 (M⁺)

【0167】

【表 50】

表 3



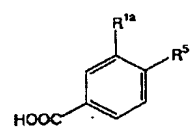
Ph: フェニル基

化合物 番号	構 造 式		化合物 番号	構 造 式	
	R <sup>5</sup>	R <sup>1a</sup>		R <sup>5</sup>	R <sup>1a</sup>
1		Cl	7		NH <sub>2</sub>
2		Cl	8		
3		CH <sub>3</sub>	9		H
4		OH	10		CN
5		CF <sub>3</sub>	11		Br
6		NO <sub>2</sub>	12		Br

【0168】

【表51】

表 3 (つづき)



Ph: フェニル基

化合物 番号	構 造 式		化合物 番号	構 造 式	
	R <sup>5</sup>	R <sup>1a</sup>		R <sup>5</sup>	R <sup>1a</sup>
13		H	18		NO <sub>2</sub>
14		Cl	19		CF <sub>3</sub>
15		Br	20		OCH <sub>3</sub>
16		Cl	21		Br
17		NH <sub>2</sub>			

【0169】

【表52】

表 3 (つづき)

化合物 番 号	構 造 式
22	
23	
24	
25	
26	
27	

【 0 1 7 0 】

【表 5 3】

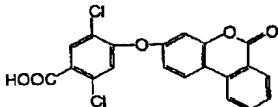
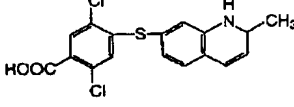
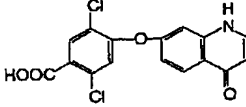
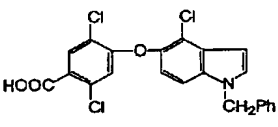
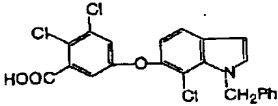
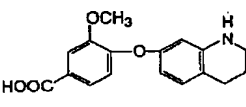
表 8 (つづき)

化合物 番 号	構 造 式
28	
29	
30	
31	
32	
33	

【 0 1 7 1 】

【表 5 4】

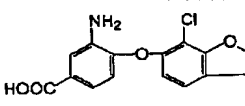
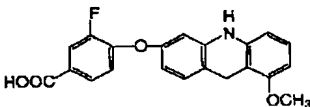
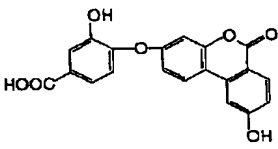
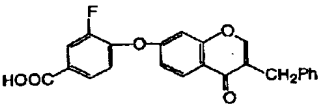
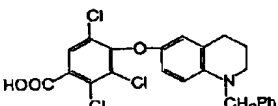
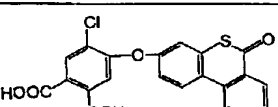
表 3 (つづき)

化合物 番 号	構 造 式
34	
35	
36	
37	
38	
39	

【 0 1 7 2 】

【表 5 5】

表 3 (つづき)

化合物 番 号	構 造 式
40	
41	
42	
43	
44	
45	

フロントページの続き

(51) Int. Cl. <sup>6</sup>

C 0 7 D 31/30

335/16

401/04

2 0 9

401/06

2 0 9

// A 6 1 K 31/34

9454-4C

31/35

9454-4C

31/38

A D U

9454-4C

31/40

A C V

9454-4C

A E D

9454-4C

31/44

9454-4C

31/47

9454-4C

C 1 2 N 9/99

識別記号

庁内整理番号

F I

技術表示箇所

(72)発明者 原 弘  
千葉県我孫子市天王台5丁目5番2-902  
号

(72)発明者 神徳 宏  
茨城県つくば市松代3丁目25番4-203号